清熱藥

清解裏熱為主要作用的藥物

清熱藥

- 以清泄裡熱為主要作用的藥物。
- 具有清熱瀉火、解毒、涼血、清虛熱等功效，
- 主要用於熱病高熱、熱痢、癰腫瘡瘍以及陰虛內熱等所呈現的各種裡熱証候。
- 性屬寒涼，多入肺、胃、心、肝、大腸經。

裏熱證

- 主要是由於外邪入裡化熱，或內鬱化火所致的一類証候。
  - 外邪入裡化熱的証候與各種急性傳染病、急性感染性疾病，特別是伴全身毒血症時的表現相似，如高熱、汗出、口乾、煩躁、神昏瞻語等。
  - 臟腑偏勝，鬱而化火(熱)之證與現代醫學中各種器官或組織的感染性疾病相似。
- 血分實熱：斑疹和鼻衄、牙齦出血、吐血、便血，及煩躁、神昏瞻語等症狀。

裏熱證2

- 虛熱多由精虧血少、陰液大傷而內生，出現口乾唇燥、虛煩不寐、盜汗，可見於現代醫學中大病後期體質虛弱，以及結核病等。
- 主要病因是病原微生物感染，其病理過程包括發熱、炎症、疼痛、腹瀉、中樞症狀等。
- 包括某些出血性疾病、頭痛眩暈症、過敏性疾病及腫瘤等非感染性疾病。

清熱藥依功效分類

1. 瀉火，
2. 涼血，
3. 解毒，
4. 清虛熱，

清熱藥依性能分類

1. 清熱瀉火藥：知母、梔子、夏枯草
2. 清熱涼血藥：牡丹皮、芍藥、紫草
3. 清熱燥濕藥：黃芩、黃連、龍膽
4. 清熱解毒藥：金銀花、連翹、魚腥草
5. 清虛熱藥　：青蒿、地骨皮

主要藥理作用

抗病原微生物作用

1. 病原微生物：
   1. 可視為外邪，
   2. 是引起各種感染、炎症性疾病的主要因素。
   3. 在體內各器官的生長繁殖，能造成多種組織損傷和功能活動的改變。

抗菌作用

1. 金銀花、連翹、黃芩、黃連、大青葉、板藍根、魚腥草、苦參等：對革蘭陽性菌(如金黃色葡萄球菌、溶血鏈球菌、肺炎雙球菌等)、革蘭陰性菌(如大腸桿菌、變形桿菌、痢疾桿菌、傷寒桿菌、腦膜炎雙球菌等)都有一定的體外抑制作用，
2. 黃連、秦皮、銀花、知母、黃芩、黃柏及黃連解毒湯、龍膽瀉肝湯等：對淋病雙球菌的抑制作用較強；
3. 知母、蒲公英、黃柏：有抗變形鏈球菌作用；

抗菌作用

4. 黃連、黃芩、秦皮等對幽門和空腸彎曲桿菌有抑制作用。
5. 黃連、黃柏、黃芩、銀花、連翹、苦參、梔子等對多種致病性的皮膚真菌有明顯的抑制作用。
6. 抗菌的有效成分：小蘗鹼、黃芩素、氯原酸、異氯原酸、木犀草素、癸素、苦參鹼和穿心蓮內酯等。

抗菌機理

- 黃連、黃柏、龍膽草：
  - 破壞菌體架構，細胞膜出現皺縮並折入胞漿內;
  - 抑制核酸、蛋白質合成;
  - 干擾糖代謝。

抗菌有效成分

- 小蘗鹼(黃連、黃柏、三棵針)、
- 黃芩素(黃芩)、
- 綠原酸、異綠原酸(金銀花)、
- 秦皮乙素(秦皮)、
- 苦參鹼(苦參、山豆根)、
- 連翹酯苷(連翹)、
- 色胺酮(板藍根、青黛)、
- 癸醯乙醛(魚腥草)等。

抗菌有效成分

- 與抗生素作用之間差異。
  - 清熱藥用於急性感染性疾病，臨床療效確切，改善全身症狀顯著，
  - 體外實驗結果顯示，無論單味藥還是其有效成分的抗菌作用強度，一般均不及抗生素，說明清熱藥抗感染作用是透過多種作用產生的。
  - 除抗病原體作用外，抗細菌毒素、解熱、影響免疫功能等也參與了抗感染作用。

體內試驗的印證

1. 有明顯的治療效果：

   1) 黃連解毒湯對實驗性細菌性腹膜炎、

   2) 黃連素對實驗性敗血症

2. 在六十多味清熱藥中，並沒有發現一個像抗生素(如青霉素、鏈霉素)那樣具有很強的體內外抗菌作用的中草藥單獨應用於臨床。

體內試驗的印證

1. 清熱藥的抗菌力不強可能原因：
   1) 大多數清熱藥的抑菌作用都是體外試驗。體外試驗，其抗菌效能與抗生素相比，差距很大，一般都比較低。因此，進入體內後能否達到有效的抗菌濃度，尚待進一步研究。
   2) 中草藥中的雜質較多，除含抗菌成分外，所含的揉質、藥液的酸鹼度等都可通過物理或非特異性機理抑菌而影響抗菌作用。

體內試驗的印證

1. 清熱藥的抗菌力不強可能原因：

   3) 中藥品種、炮炙、採收季節等均可影響抗菌效果：

      1. 大青葉有七科十六種，所含有效成分的多少不一，其抗菌作用就有很大差異;
      2. 千里光五月份採收的抗菌作用較一月份採收的抗菌作用強兩倍;
      3. 魚腥草鮮品抗菌力較乾品強。

抗菌作用與臨床療效存在差異

1. 穿心蓮內酯、苦參、白花蛇舌草等臨床有效，而體外抑菌試驗無效。
2. 穿心蓮水溶性黃酮部分體外試驗有效，進入體內後卻無效;複方也有類似情況。
3. 黃連、蒲公英及黃柏複方等在低濃度時就可破壞細菌超微結構，從膜的損傷至核膜、線粒體的破壞;黃柏複方還能消除白色念珠菌在卡那霉素處理小鼠腸道的定居，

抗病毒作用

1. 體外試驗和臨床實踐證明：
   1) 銀花、連翹、黃芩、牡丹皮、赤芍、大青葉、板藍根、魚腥草、地骨皮、紫草、野菊花、射乾、青蒿素等對流感病毒亞甲型有明顯的抑制作用;
   2) 蒲公英、敗醬草、夏枯草、赤芍、銀花等對單純皰疹病毒有抑制作用;

抗病毒作用

1. 體外試驗和臨床實踐證明：
   3) 大青葉對乙腦病毒、腮腺炎病毒以及赤芍對副流感病毒、腸道病毒均有一定的抑制效果;
   4) 夏枯草、梔子、蚤休、半枝蓮對乙型肝炎病毒有效。
   5) 用對流免疫電泳(CIEP)法測得黃芩、赤芍、馬勃、大青葉、蒲公英、板藍根、半枝蓮、知母、連翹、魚腥草等對乙肝抗原(HBsAg)有抑制作用。

抗病毒作用

1. 體外試驗和臨床實踐證明：
   1) 臨床研究證實，苦參鹼有抑制乙肝病毒複制作用。
   2) 黃連、黃芩、生地、蒲公英能誘生乾擾素，阻礙病毒複制。
   3) 紫花地丁、黃連、紫草、穿心蓮、金銀花、蟛蜞菊、夏枯草等還有抑制艾滋病毒(HIV)作用，黃芩對HIV逆轉錄酶的抑制作用也很強。

抗毒素作用

1. 直接作用：降解內毒素，拮抗外毒素。
   1) 降解內毒素作用。
      A. 內毒素(Endotoxin)：
         a) 是革蘭陰性菌細胞壁上的一種脂多糖。
         b) 當細菌死亡細胞壁崩解時釋放出來，
         c) 可由活菌以發泡方式釋放出來。
         d) 有複雜的生物活性，如可引起發熱，循環障礙、休克及彌漫性血管內凝血。

抗毒素作用

e) 隨著抗生素的大量運用，革蘭陽性菌感染己逐漸下降，革蘭陰性菌感染相應增加，而目前絕大部分抗生素對內毒素無效。

f) 銀花、連翹、蒲公英、敗醬草等有抗內毒素的作用，以前兩個為強，並發現龍膽瀉肝湯能明顯降低實驗性內毒素血症動物血漿中內毒素的含量;

抗毒素作用

g) 清解靈（白頭翁、蒲公英、敗醬草、大黃、甘草)、熱毒清（金銀花、蒲公英、大青葉、魚腥草)等能直接破壞和降解內毒素的形態結構，使其失去毒性。

h) 經“清解靈”處理過的內毒素與多粘菌素B處理過的內毒素從電鏡下觀察到兩者結構變化相同，使內毒素的鏈狀盤繞結構崩解呈板狀或短片狀。

i) 熱毒清還對內毒素所致的溶　體膜的損傷有保護作用。

抗毒素作用

B. 拮抗外毒素（Exotoxin）作用：

a) 是細菌分泌到體外的物質，毒力大，
b) 對機體組織有選擇性的毒害作用，
c) 小蘗鹼能使霍亂弧菌毒素所致腹瀉潛伏期延長以及腹瀉程度減輕，顯示其抗外毒素的作用。

2. 間接作用：降低細菌的毒力

A. 抗透明質酸酶作用。

a) 透明質酸是結締組織的基質成分之一，能被透明質酸酶破壞，使結締組織酥鬆，使細菌、毒素能在結締組織中擴散，造成感染蔓延。

b) 射乾等有抗透明質酸酶的作用，故可阻止細菌、毒素在結締組織中的擴散，間接降低細菌的毒力。

2. 間接作用：降低細菌的毒力

B. 抑制凝固酶的形成。

a) 多數致病性的葡萄球菌能產生一種　原，在血漿和組織中形成血漿凝固酶，使血漿凝固，並使炎症滲出物中的纖維蛋白原變成纖維蛋白，附著在細菌表面，使其不易被吞噬或在吞噬細胞中不易被破壞，

b) 黃芩、知母、牡丹皮及黃連解毒湯在低於抑菌濃度時就能抑制凝固酶的形成，有利於細菌在體內的消滅。

解熱作用

1. 發熱是溫熱病的主要症狀，患者體溫的變化也是臨床觀察藥效和病情發展的重要特徵。
2. 細菌、病毒、內毒素均可引起內熱原釋放而致熱，
3. 石膏、知母、水牛角、羚羊角、黃芩、黃連、銀花、魚腥草、大青葉、板藍根、地骨皮、紫草、穿心蓮、青蒿、白虎湯、清瘟敗毒飲、黃連解毒湯等對動物實驗性發熱模型均有較好的退熱作用，

抗發炎作用

1. 炎症是產生裏熱證候的重要原因。
2. 大青葉、板藍根、銀花、連翹、黃連、黃柏、黃芩等對多種致炎劑(角叉菜膠、二甲苯、蛋清、巴豆油和甲醛)引起的實驗性炎症均有一定的抑制作用。
3. 黃連解毒湯對金黃色葡萄球菌所致的感染炎症有效，

抗發炎作用

4. 穿心蓮、秦皮等能明顯興奮垂體-腎上腺系統的作用;
5. 黃芩、紫草、魚腥草等對環氧化酶、脂氧化酶二途徑多種產物生成有抑制作用，
6. 紫草素能抑制白三烯B4(LTB4)的合成，這可能是其抗發炎、解毒、解熱作用的重要機理。

對非特異性免疫功能的影響

1. 增加白血球數，促進白血球和單核巨噬細胞的吞噬功能，如蒲公英、銀花、生地、丹皮、魚腥草、野菊花、穿心蓮等。
2. 提高體內自身的抗菌物質，如魚腥草能提高體內溶菌　的活性和血漿備解素的水平;
3. 溶菌　是一種鹼性蛋白，有溶解革蘭陽性菌細胞壁的作用;
4. 備解素和補體是血中特殊蛋白，能增強機體對革蘭陰性菌感染的抵抗力。

對特異性免疫功能的影響

1. 對細胞免疫的作用。
   1) 山豆根、黃連、黃芩、蒲公英、銀花等可提高淋巴細胞的轉化率，促進細胞免疫作用;
   2) 氧化苦參鹼、穿心蓮內酯、青蒿素、丹皮酚及白鮮皮、魚腥草、黃芩等均具有抗過敏作用。
2. 對體液免疫的作用。
   1) 黃柏、白鮮皮和黃連解毒湯有抑制體液免疫的作用。

對特異性免疫功能的影響

3. 與免疫抑制劑皮質激素不同：清熱藥只對免疫過程的某個機制有效，而免疫抑制劑對多個機制均有影響。
4. 與抗生素更不同：抗生素在治療感染性疾病時，多不影響免疫功能。

抗腫瘤作用

1. 清熱解毒是中醫治療惡性腫瘤的基本治則，
2. 體外試驗和動物試驗證明廣豆根、青黛、紫草、苦參、知母、半枝蓮、白花蛇舌草、地骨皮、穿心蓮、青蒿素、赤芍和六味地黃湯等對多種實驗性癌腫有明顯的抑制作用。
3. 有人以人早幼粒白血病細胞株(HL-60)作為靶細胞，對39種清熱解毒類中藥水提液對靶細胞的殺傷作用進行了觀察，結果發現有25種中藥對靶細胞有明顯的殺傷作用。
    1. 山豆根、銀花、黃芩、地骨皮、七葉一枝花等7種中藥在5μl/ml濃度(1mg/ml)下能完全殺死靶細胞，
    2. 夏枯草、黃柏、半枝蓮、虎杖等在10μl/ml濃度可殺死靶細胞。

抗腫瘤作用

1. 中藥常用的抗癌方藥，均有一定抗癌效果：
   1. 抗癌乙丸(山豆根、草河車、夏枯草、白鮮皮、敗醬草、黃藥子)、
   2. 清瘤片(紫河車、腫節風、山豆根、半枝蓮、白花蛇舌草等)。

消除自由基作用

1. 目前所知，吞噬殺菌、癌變、衰老等都與自由基有關。
2. 正常機體所產生的自由基，可被自由基清除系統所清除，並不影響正常生理功能，
3. 在某些病理過程中所產生過多的自由基，則可嚴重損傷組織細胞，而引起器官功能的異常改變。
4. 自由基是體內的有“毒”物質，也可視為內毒，

消除自由基作用

5. 中醫所說的“毒”不僅包括細菌、病毒、毒素，也可包括自由基。
6. 熱毒清能直接抑菌，拮抗內毒素引起的彌漫性血管內凝血，能使內毒素網狀結構崩解，還有較強的清除自由基的作用，
7. 認為致病菌和內毒素在體內可誘發自由基，即可謂"外毒入內，內毒中生"。

1. 黃芩、羚羊角、赤芍、丹皮有鎮靜、抗驚作用;
2. 知母有抗血小板聚集作用;
3. 黃連、黃芩、丹皮有降血壓作用;
4. 黃芩、連翹、蒲公英、梔子等有保肝作用;
5. 生地黃有強心作用;
6. 秦皮、黃連、苦參、馬齒莧有利尿作用;
7. 黃連、黃柏有抑制胃腸運動的作用;
8. 七葉一枝花、穿心蓮、龍葵還有抗蛇毒作用。

綜 述

1. 清熱藥的藥理作用相當廣泛，其治療各種熱證的原因可能是群體效應的結果。
2. 通過抗菌、抗病毒、抗毒素消滅病邪內傳或消除已侵入臟腑的病邪;
3. 通過解熱、抗發炎、抗過敏、抗腫瘤緩解症狀;
4. 通過提高體內抗菌物質的含量和促進免疫功能而增強機體的抗病能力和促進組織損傷的修復。

綜 述

1. 在治療嚴重細菌感染性疾病時，清熱藥若能與抗生素聯合應用，既可發揮抗生素較強抑殺細菌的作用，又可發揮清熱藥增強免疫、清除內毒素等的作用，可達到菌毒並治，發揮兩個優勢，起到祛邪而不傷正的效果。

黃芩

- 基原：唇形科草本植物的乾燥根

1. 黃芩*Scutellaria baicalensis* Georgi
2. 黏毛黃芩*S. viscidula* Bge，
3. 滇黃芩*S. amoena* C. H. Wright，
4. 甘肅黃芩*S. Rehderiana* Diels，
5. 薄葉黃芩*S. ikonnikovii* Juz，
6. 麗江黃芩*S. likiangensis*
7. 川黃芩*S. hypericifolia* Level.

黃芩

- 主要化學成分：
  - 黃酮類：黃芩苷 (baicalin)、黃芩素 (黃芩苷元，baicalein)，漢黃芩苷 (wogonoside)、漢黃芩素 (wogonin)，千層紙素A(oroxylin-A)，黃芩新素I(skullcapfavone I)，黃芩新素II(skulcapfavone II)等。
  - β-谷淄醇、苯甲酸、葡萄糖醛酸和微量元素。
- 味苦，性寒。歸肺、膽、胃、大腸經。

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：具有清熱燥濕，瀉火解毒，止血，安胎。
- 用於濕溫、暑溫，胸悶嘔惡，濕熱痞滿，瀉痢，黃疸，肺熱咳嗽，高熱煩渴，血熱吐衄，癰腫瘡毒，胎動不安。
- *本草經疏*：其性清肅，所以除邪;味苦所以燥濕;陰寒所以勝熱。故主諸熱，邪熱與濕熱也。
- *名醫別錄*：療痰熱、胃中熱。

(1)抗病原體

- 黃芩生品及炮製品對痢疾桿菌、綠膿桿菌、金黃色葡萄球菌有效，對變形桿菌、大腸桿菌、肺炎雙球菌、甲型溶血性鏈球菌的抑制作用較差。
- 生黃芩的作用優於炮製品，但冷浸黃芩的作用比加熱處理者低。
- 黃芩水浸劑對多種皮膚真菌有抑制作用，黃芩苷元對尖孢鐮刀菌和白色念珠菌的生長有抑制作用。
- 黃芩與柴胡配伍，能抑制流感病毒對雞胚的感染，降低感染病毒小鼠的死亡率，減輕其肺部病變。
- 黃芩苷有抗內毒素作用，能減輕內毒素對細胞膜架構的損傷作用。

(2)抗發炎

- 黃芩水煎醇沉液灌胃，對大鼠酵母性足腫脹有明顯抑制作用。
- 黃芩甲醇提取物、黃芩素、黃芩苷灌胃，均能抑制大鼠角叉菜膠性足腫脹。
- 黃芩素及漢黃芩素對大鼠佐劑性關節炎也有抑制作用。
- 黃芩莖葉總黃酮口服給藥，對二甲苯致小鼠耳腫脹和甲醛致大鼠足蹠腫脹均有明顯的抑制作用，對棉球肉芽腫影響不明顯。
- 黃芩甲醇提取物及黃酮單體能抑制醋酸引起的小鼠腹腔毛細血管通透性增加。

- 黃芩抗發炎作用與抑制炎性介質的生成和釋放有關，
- 黃芩新素II、漢黃芩素、漢黃芩苷、黃芩素等均能抑制大鼠腹膜肥大細胞釋放組織胺。
- 花生四烯酸的代謝產物是重要的炎性介質，黃芩素、黃芩苷能影響花生四烯酸代謝，不同程度地抑制前列腺素E(PGE)和白血球三烯 (LT)的生成，從而減輕炎性介質擴張血管、增加血管壁通透性及白血球的趨化作用。

(3)對免疫功能的影響

- 黃芩具有抗免疫反應作用，尤其對I型過敏反應作用顯著。I型過敏反應常因多種外來過敏原引起，由IgE抗體介導，引起肥大細胞釋放血管活性胺(組織胺、5-HT)及其他炎性介質，導致全身和局部的過敏反應。
- 黃芩苷可抑制小鼠被動皮膚過敏反應。
- 黃芩苷、黃芩素等對致敏豚鼠離體回腸及氣管有明顯的解痙作用，黃芩苷對實驗性哮喘也有一定的抑制作用。

(3)對免疫功能的影響

- 黃芩免疫抑制作用機制：
  - 穩定肥大細胞膜，減少炎性介質釋放。黃芩苷可減少致敏豚鼠離體肺灌流液中慢反應物質 (SRS-A) 的含量，黃芩苷也能顯著抑制肥大細胞釋放組織胺;
  - 影響花生四烯酸代謝，抑制炎性介質的生成。黃芩苷明顯抑制鈣離子載體A3187誘導的大鼠腹腔巨噬細胞PGE2合成增加。

- 黃芩具有提升機體免疫功能作用：黃芩苷鋅絡合物腹腔注射，連續5日，能明顯提升小鼠腹腔巨噬細胞吞噬百分率和吞噬指數，並使血清溶菌酶含量及紅細胞補體C3bR酵母花環形成百分率明顯提升。
- 黃芩苷劑量在10-320 μg/mL範圍內，可使NK細胞活性隨劑量增加而增強，劑量大於640 μg/mL時，NK細胞活性反而明顯降低，說明黃芩苷增強NK細胞活性有濃度倚賴關係。
- 黃芩苷及黃芩苷元均能抑制免疫缺陷病毒 (HIV-l)及免疫缺陷病毒逆轉錄酶 (HIV-1 RT)的活性，黃芩苷元作用強於黃芩苷。

(4)解熱

- 黃芩莖葉總黃酮口服給藥，對酵母引起的大鼠發熱有顯著的解熱作用。
- 黃芩苷腹腔或靜脈注射對發熱大鼠也有明顯的解熱作用，並呈一定的量效關係。
- 黃芩苷對正常體溫大鼠無降溫作用。

(5)保肝、利膽

- 黃芩瀉火解毒，主治諸熱黃疸。
- 黃芩及黃芩提取物等對半乳糖胺、四氯化碳誘導的實驗性肝損傷有保護作用。
- 原代培養大鼠肝細胞受四氯化碳損傷後，細胞培養液中ALT活性明顯升高，黃芩的乙酸乙酯萃取物和正丁醇萃取物均可使其顯著降低。
- 黃芩的保肝作用可能與抗氧自由基損傷有關。
- 黃芩莖葉總黃酮灌胃可增加小鼠肝勻漿中谷胱甘肽過氧化物酶(GSH-PX)的活性，明顯降低過氧化脂質(LPO)的含量;

(5)保肝、利膽

- 千層紙素A、漢黃芩素、黃芩新素II、黃芩素、黃芩苷等，口服或體外給藥能抑制氯化亞鐵和抗壞血酸的混合物激活的肝臟脂質過氧化作用。
- 黃芩黃酮對NADPH-ADP引起的體外肝臟脂質過氧化作用也有明顯抑制作用。
- 黃芩及其有效成分黃芩素等可促進實驗動物膽汁分泌，顯示利膽作用。

(6)鎮靜

- 中醫認為火邪為陽邪，其性炎上，引起心煩失眠等症。
- 黃芩清熱瀉火，有中樞抑制作用，能減少小鼠自發活動，協同閾下催眠量的戊巴比妥鈉催眠作用。

(7)對血液系統影響

- 黃芩有止血功效，主治血熱吐衄，但對血液系統的作用較為複雜。
- 黏毛黃芩、滇黃芩、薄葉黃芩中的黃芩苷水溶性成分具有促凝血和明顯的延長纖維蛋白溶解活性作用，而黃芩及甘肅黃芩的水溶性成分則無明顯作用。
- 黃芩素、漢黃芩素、千層紙素、黃芩新素II等能不同程度地抑制膠原、ADP、花生四烯酸誘導的血小板聚集，抑制凝血酶誘導的纖維蛋白原轉化為纖維蛋白，產生抗凝血作用。

2. 其他藥理作用

(1)降血脂、抗動脈粥狀硬化

- 對實驗性高脂血症大鼠，口服漢黃芩素，黃芩新素II，可升高血清高密度脂蛋白膽固醇 (HDL-C)濃度，
- 黃芩新素II還能降低血清總膽固醇 (TC)濃度，黃芩素、黃芩苷能降低血清甘油三酯 (TG)含量。
- 黃芩莖葉總黃酮也有明顯降血脂及抗動脈粥狀硬化作用。

(2)抗氧自由基損傷

- 黃芩苷對心、肺、晶狀體有抗氧自由基損傷作用。
- 黃芩苷連續腹腔注射3天，可對抗阿霉素引起的脂質過氧化損傷，提升小鼠心肌超氧化物歧化酶(SOD)和GSH-PX活性，降低丙二醛(MDA)含量，從而減輕自由基對心肌的損傷。
- 黃芩苷對過氧亞硝基陰離子(ONOO-)致大鼠肺損傷也有明顯保護作用。
- 黃芩苷可對抗亞硒酸鈉誘導的白內障晶狀體損傷，提升晶狀體的抗氧化能力。

(3)降血壓、抗心肌缺血、抗心律失常

- 早年研究：
  - 黃芩水浸液、黃芩提取物靜脈注射可引起動物血壓下降，反覆給藥無快速耐受現象。
  - 黃芩苷有擴血管作用，可對抗NA、KCl及CaCl2所致的大鼠離體主動脈條收縮，使量效反應曲線右移，但最大收縮效應降低。
- 近來研究：
  - 黃芩苷對培養的大鼠主動脈平滑肌細胞內游離鈣濃度有降低作用，推測其降血壓作用與阻滯鈣通道有關。

- 黄芩苷：
  - 可對抗異丙腎上腺素所致大鼠急性心肌損傷，使缺血心電圖S-T段異常抬高數減少，血清磷酸肌酸激酶(CPK)降低。
  - 對大鼠心肌收縮性有明顯抑制作用，可使心肌耗氧量減少。
- 黃芩莖葉總黃酮灌胃：
  - 對靜脈注射垂體後葉素引起的大鼠心肌缺血有明顯的對抗作用，並可增加離體豚鼠的冠脈流量。
  - 對烏頭鹼誘發大鼠的心律失常、大鼠冠脈結扎複灌性心律失常及電刺激家兔心臟誘發室顫均有明顯的對抗作用，可增加哇巴因誘發豚鼠心律失常的閾劑量，但對致死劑量無明顯影響。

- 可明顯延長小鼠常壓缺氧的存活時間，增強動物的抗缺氧能力;

- 黃芩苷、黃芩素能降低實驗性糖尿病大鼠醛糖還原酶活性，減輕糖尿病慢性併發症，使晶狀體、腎臟病理變化得到明顯改善。
- 黃芩中酚性苷類能減輕放射引起的組織損傷，提升小鼠存活率。

黃芩綜述

- 清熱燥濕、瀉火解毒：與其抗病原體、抗發炎、調節免疫功能、解熱、鎮靜、保肝、利膽、促凝血等藥理作用有關。
- 主要有效成分為黃酮類。

現代應用

1. 小兒呼吸道感染：50%黃芩水煎液治療小兒上呼吸道感染、急性支氣管炎及扁桃體炎。
2. 急性菌痢：黃芩素治療急性菌痢。
3. 病毒性肝炎。
4. 其他感染：節疔、外癰、蜂窩組織炎和深部膿腫。

不良反應

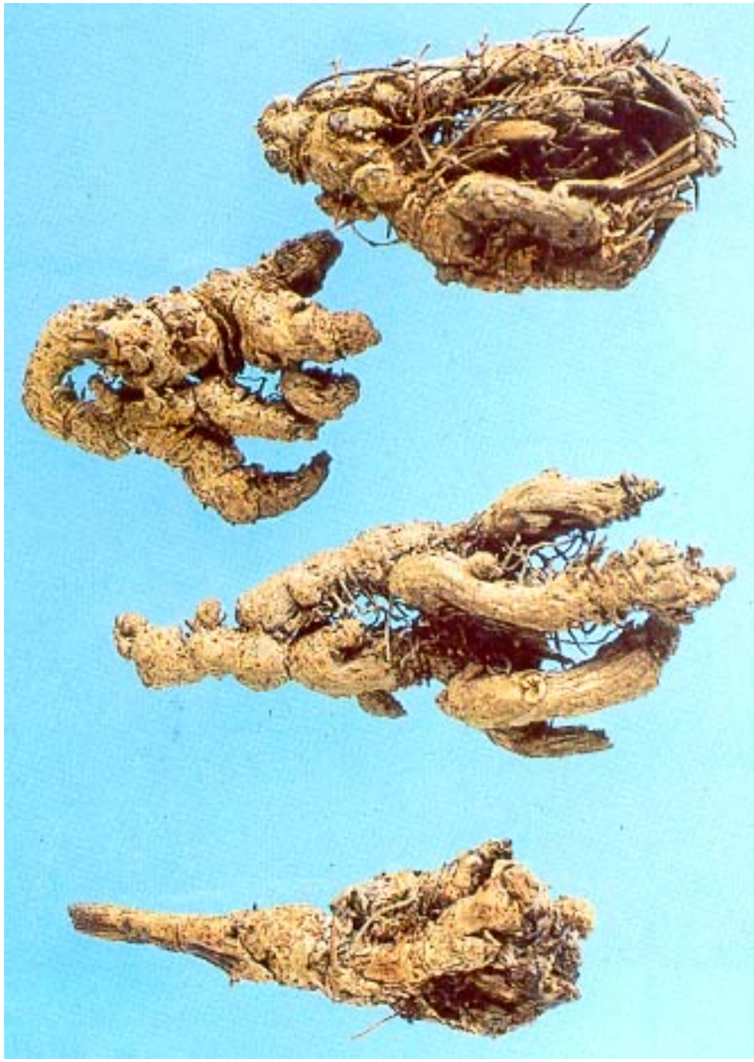
- 犬口服浸劑每日15g/kg，連續8周，除可見糞便稀軟外，未見其他明顯毒性。
- 生黃芩浸劑注射毒性較大，給家兔靜脈注射2 g/kg可引起死亡。
- 小鼠腹腔注射黃芩苷的LD_{50}為3.081 g/kg。

黃　連

- 毛莨科植物的乾燥根莖：
  - 黃連*Coptis chinensis* Franch.、
  - 三角葉黃連*Coptis deotoidea* C. Y. Cheng et Hsiao.，
  - 雲連*Coptis teeta* Wall.
- 上述三種黃連分別習稱為味連、雅連和雲連。
- 味苦，性寒。
- 歸心、脾、胃、肝、膽、大腸經。

1

3



黃連根莖

- 含有多種生物鹼，包括小蘗鹼(黃連素 berberine)、黃連鹼(Coptisine)、掌葉防己鹼(巴馬亭palmatine)、藥根鹼(jatrorrhizine)、表小蘗鹼(epiberberine)、甲基黃連鹼(Worenine)、非洲防己鹼(columbamine)、木蘭花鹼(magnoflorine)等。
- 其中以小蘗鹼含量最高，黃連、三角葉黃連及雲連中小蘗鹼含量均超過4%。
- 小蘗鹼是黃連所含的重要有效成分。

與功效主治相關的藥理作用

1. 功效：清熱燥濕，瀉火解毒。

- 主治：濕熱痞滿，嘔吐，瀉痢，黃疸，高熱神昏，心火亢盛，心煩不寐，血熱吐血，目赤吞酸，牙痛，消渴，癰腫瘡瘡；外用可治療濕疹，濕瘡，中耳炎。
- 本草正義：黃連大苦大寒，苦燥濕，寒勝熱，能泄降一切有餘之濕火，而心、脾、肝、腎之餘熱，膽、胃、大小腸之火，無不治之。
- 上清風火之目病，中平肝胃之嘔吐，下通腹痛之滯下，皆燥濕清熱之效也。

(1)抗病原體

- 黃連清熱燥濕，瀉火解毒功效之主要基礎。
- 抗菌譜及抗菌機制：
  - 黃連及小蘗鹼具有廣譜抗菌作用，對多種細菌、結核桿菌及真菌等有抑制或殺滅作用。
  - 雲連、雅連、味連在體外對金黃色葡萄球菌、溶血性鏈球菌、大腸桿菌、綠膿桿菌、痢疾桿菌、傷寒桿菌及陰溝桿菌共7種16株致病菌均有抑制作用，
  - 黃連水浸出液5 mg/mL與小蘗鹼0.5 mg/mL比較，無論在抑制菌株數或抑菌率方面，黃連水浸出液均優於小蘗鹼。

- 黃連具有抗真菌作用。
- 巴馬亭、藥根鹼對凱爾酵母菌、白色念珠菌等有抗菌作用。黃連煎液及小蘗鹼在體外及體內均有一定的抗阿米巴作用。小蘗鹼對多種流感病毒及新城雞瘟病毒有抑制作用。
- 黃連低濃度抑菌，高濃度殺菌。

抗菌作用機制

1. 破壞細菌結構：黃連最低殺菌濃度0.66 g/mL能引起金黃色葡萄球菌中隔變形、彎曲和粗細不一，在細胞質中，染色顆粒消失、細胞質變蒼白，核糖體處出現高電子密度的團塊。

- 將石膏樣癬菌接種在40%黃連藥液培養基中，培育7日後可引起真菌細胞膜明顯皺縮，反折入胞漿內，胞漿內細胞器消失。

抗菌作用機制

2. 抑制細菌糖代謝：黃連能抑制酵母菌及細菌糖代謝的中間機制丙酮酸的氧化脫羧過程。

3. 抑制核酸、蛋白質合成：小蘗鹼能干擾肺炎球菌^{14}C-苯丙氨酸、^{14}C-胸腺嘧啶核苷及^{14}C-尿嘧啶核苷的摻入作用，影響核酸代謝。小蘗鹼還能抑制霍亂弧菌的RNA和蛋白質合成。

炮製及配伍對黃連抗菌作用的影響

- 酒黃連、姜黃連和萸黃連與黃連比，體外抗綠膿桿菌作用加強，但抗金黃色葡萄球菌、傷寒桿菌、痢疾桿菌、溶血性鏈球菌、變形桿菌的作用強度無明顯變化。
- 黃連、黃芩、甘草水煎液單味或不同比例配伍後對金黃色葡萄球菌生長的抑制作用發生影響。
  - 黃連與黃芩配伍，黃連的抑菌作用未見降低;
  - 黃連與甘草配伍，無論比例如何，配伍後黃連的抑菌作用均呈降低趨勢。
  - 當三藥同時配伍時，黃連的抑菌作用不變，或反增強。

(2)抗細菌毒素、抗腹瀉

- 黃連及小蘗鹼能提升機體對細菌內毒素的耐受能力。
- 黃連能對抗大腸桿菌引起的腹瀉;
- 小蘗鹼能對抗霍亂毒素引起的腹瀉，並減輕小腸絨毛的水腫、分泌亢進等炎症反應，降低死亡率。
- 小蘗鹼對非感染性腹瀉也有對抗作用，如抗蓖麻油及番瀉葉引起的腹瀉。

(3)抗發炎、解熱

- 小蘗鹼：
  - 對急慢性炎症均有抑制作用。
  - 皮下注射可抑制二甲苯引起的小鼠耳腫脹。
  - 對大鼠角叉菜膠性足距腫脹、慢性棉球肉芽腫均有明顯抑制作用。
  - 可抑制乙酸引起的小鼠腹腔毛細血管通透性增高，對組織胺引起的大鼠皮膚毛細血管通透性增加也有抑制作用。

(3)抗發炎、解熱

- 抗發炎作用機制：
  - 能明顯抑制趨化因子ZAP誘導的中性粒細胞趨化作用，抑制酵母多糖誘導的多形核白血球化學發光反應，對白血球系產生的烴自由基及過氧化氫導致的化學發光亦有顯著的抑制作用;
  - 靜脈滴注可明顯降低大鼠炎症組織中前列素E2(PGE2)的含量。
  - 能明顯降低中性粒細胞中磷脂酶A2（PLA2）的活性，減少炎性介質的生成。

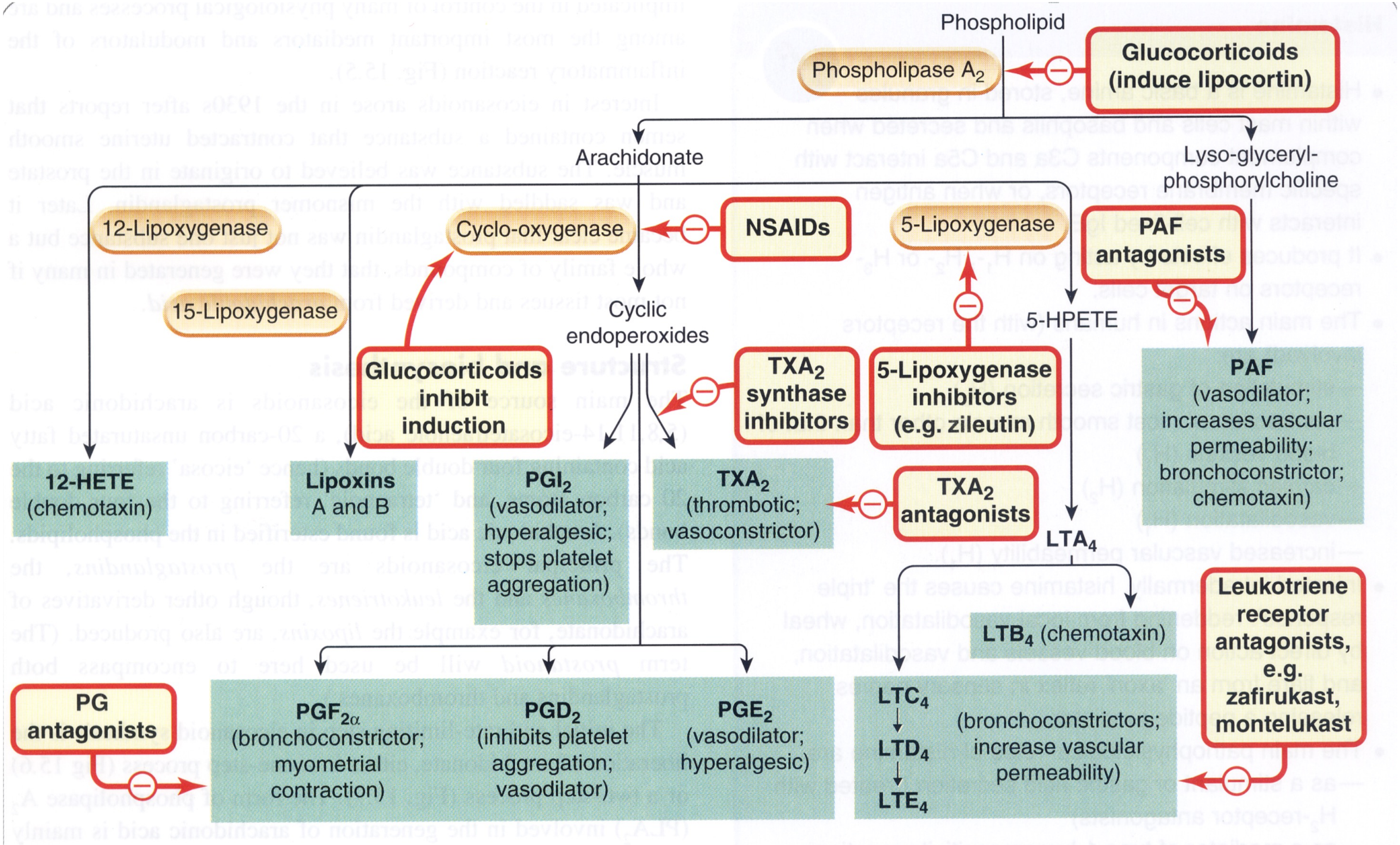


Fig. 15.5 Summary diagram of the inflammatory mediators derived from phospholipids with an outline of their actions, and the sites of action of anti-inflammatory drugs. The arachidonate metabolites are 'eicosanoids'. The glucocorticoids inhibit transcription of the gene for cyclooxygenase-2, which is induced in inflammatory cells by inflammatory mediators. The effects of PGE_2 depend on which of the three receptors for this prostanoid are activated; see text. (PG, prostaglandin; PGI_2, prostacyclin; TX, thromboxane; LT, leukotriene; HETE, hydroxyeicosatetraenoic acid; HPETE, hydroperoxyeicosatetraenoic acid; PAF, platelet-activating factor; NSAIDs, non-steroidal anti-inflammatory drugs; see Ch. 16.)

- 藥根鹼及黃連鹼也有顯著的抗發炎作用。
- 黃連注射液：
  - 對白血球致熱原所致家免發熱有明顯解熱作用，
  - 能降低腦脊液中cAMP含量，

→黃連可通過抑制中樞發熱介質的生成或釋放而產生解熱作用。

(4)鎮靜催眠

- 心火亢盛，躁擾心神，出現心悸、失眠、多夢等症狀。
  - 黃連瀉心火，解熱毒，具有中樞抑制作用。
  - 小蘖鹼可使小鼠自發活動減少，作用持續在85分鐘以上，對戊巴比妥鈉的催眠作用能產生協同效應，可縮短後者引起小鼠睡眠的潛伏期，並使睡眠時間延長。
- 小蘖鹼、黃連鹼：
  - 均為季銨類的生物鹼，
  - 不易透過血腦屏障而中樞抑制作用較弱，
- 四氫小蘖鹼、四氫黃連鹼：
  - 叔胺類生物鹼，
  - 易透過血腦屏障而使中樞抑制作用增強。

(5)降血糖

- 黃連清胃熱，對胃火熾熱、消谷善飢、煩渴多飲的中消証有效。
- 黃連水煎液口服可使正常小鼠血糖下降，並呈量效關係。
- 小蘗鹼：
  - 能降低正常小鼠血糖，一次給藥後2~4小時內，降血糖作用最強，6小時後作用己減弱。
  - 一次灌胃給藥對葡萄糖和腎上腺素引起的血糖升高均有降低作用。

(5)降血糖

- 連續灌胃15日，對自發性糖尿病巡小鼠有降血糖作用，並能改善糖耐量，對四氧嘧啶致糖尿病小鼠也有降血糖作用。
- 可使糖尿病鼠的晶體、腎臟醛糖還原酶活性明顯下降，尿蛋白呈下降趨勢，腎小球病理變化得到明顯改善，

→小蘗鹼不僅有降血糖作用，對糖尿病性併發症也有一定作用。

- 小蘗鹼：
  - 灌胃對小鼠胰島素分泌及小鼠給葡萄糖負荷後的胰島素釋放均無明顯影響，
  - 對正常小鼠肝細胞膜胰島素受體數目及親和力亦無明顯影響，

→小蘗鹼的降血糖作用與胰島素的釋放等無關。

  - 能降低肝臟和脯肌糖原含量，抑制丙氨酸為底物的糖原異生作用，升高血中乳酸含量。

→小蘗鹼的降血糖作用是透過抑制肝臟的糖原異生和/或促進外周組織的葡萄糖酵解作用產生。

(6)抗潰瘍

- 黃連及小蘗鹼具有抗實驗性胃潰瘍作用。
- 給大鼠灌胃黃連甲醇提取液，對鹽酸-乙醇引起的胃黏膜損傷有明顯保護作用，
- 小蘗鹼對大鼠醋酸性胃潰瘍有愈合作用。
- 小蘗鹼抗潰瘍作用與其抑制胃酸分泌作用有關。
- 幽門螺桿菌感染是潰瘍病、慢性胃炎的重要發病原因，黃連對幽門螺桿菌有較強的抑蔚作用，可能是黃連治療潰瘍病的作用機制之一。

(7)抗腫瘤

- 黃連對裸鼠鼻咽腫瘤移植瘤有明顯治療作用。
- 黃連殺傷鼻咽癌細胞的作用主要表現為細胞毒作用，
- 小蘗鹼體外對艾氏腹水癌及淋巴瘤NK/LY細胞有一定抑制作用。
- 鹽酸小蘗鹼抗胃癌的作用與促進癌細胞分化有關。
- 小蘗鹼還能透過抑制癌細胞呼吸，阻礙癌細胞嘌呤和核酸的合成，干擾癌細胞代謝等途徑產生抗癌作用。

2.其他藥理作用

(1)對心血管功能的影響

- 心主血脈，心火亢盛可引起多種心血管系統功能失常。
- 黃連解毒瀉火，並以瀉心經實火見長，其抗心律失常等作用可能與此功效有關，
- 小蘗鹼對心血管作用非常廣泛，有些藥理作用與功效之間的關係尚不清楚。

正性肌力作用

- 小蘗鹼在一定劑量範圍內，對動物離體心臟及整體心臟均顯示出正性肌力作用。
- 小蘗鹼在0.1-3umol/L的劑量範圍內，呈劑量倚賴性地增加離體豚鼠乳頭狀肌收縮力，當濃度達300 umol/L時，乳頭狀肌收縮力增加50%。
- 小蘗鹼對右心房肌也產生正性肌力作用。
- 小蘗鹼對豚鼠心乳頭狀肌的等長收縮張力的增強作用可持續達40分鐘。

- 小蘗鹼有抗心力衰竭作用，靜脈注射0.1%小蘗鹼，對靜脈滴注戊巴比妥鈉引起衰竭的豚鼠心臟，可使左心室內壓變化最大速率 (dp/dt)max上升;
- 靜脈注射和口服小蘗鹼均可使心衰模型犬心排血量增加，左室舒張末壓下降，心率減慢。
- 小蘗鹼靜脈注射對清醒大鼠也有一定的強心作用。
- 小蘗鹼促進心肌細胞外Ca^{2+}內流，導致細胞內Ca^{2+}濃度增加，其正性肌力作用的機理與增加心肌細胞內Ca^{2+}濃度有關。
- 小蘗鹼用量過大反而抑制心肌收縮力。

負性頻率作用

- 小蘗鹼靜脈注射，可使清醒大鼠心率先加快而後緩慢持久地減慢。
- 小蘗鹼300 umol/L可使離體豚鼠右心房自發節律減慢15%。
- 小蘗鹼對腎上腺素引起的心率加快有非競爭性拮抗作用。

對心肌電生理特性的影響

1. 對慢反應細胞 (免竇房結、房室結細胞)，小蘗鹼0.1、1、10、30 umol/L能劑量倚賴性地降低動作電位4相去極化速率，降低自律性;降低0相去極化最大速率 (Vmax)及振幅，減慢傳導;延長動作電位時程及有效不應期，消除折返沖動。小蘗鹼對免竇房結的抑制作用不被阿托品 (1 umol/L)所拮抗。
2. 對快反應細胞 (右心房界嵴細胞)小蘗鹼也有延長動作電位時程和有效不應期作用，但需較高濃度，對動作電位振幅及V_{max}的影響不明顯。犬靜脈注射小蘗鹼血1 mg/kg，繼以每分鐘0.2 mg/kg恆速靜脈輸入，可使心房及心室有效不應期及功能不應期延長。

抗心律失常

- 小蘗鹼：
  - 具有顯著的抗心律失常作用，對多種原因誘發的實驗性心律失常有對抗作用。
  - 可使$CaCl_2$誘發的小鼠心室性早搏 (VE)、心室性心搏過速 (VT)、心室性纖顫(VF)的發生率降低，增加誘發VE、VT、VF以及心室停搏所需烏頭鹼的用量，對$BaCl_2$、腎上腺素誘發的大鼠室性心律失常、$CaCl_2$-ACh誘發的小鼠心房顫動也均有對抗作用，並能提升電刺激所誘發的家兔室顫閾值。
  - 能降低結扎冠狀動脈引起的犬缺血性心律失常(心室早博、心室顫動)的發生率。
- 藥根鹼也有抗心律失常作用。

小蘗鹼抗心律失常作用可能機制

- 與降低心肌自律性、延長動作電位時程及有效不應期，消除折返衝動有關。
- Quabine誘發的心律失常與其抑制Na^+，K^+--ATP酶，使心肌細胞內Na+增加有關，小蘗鹼能選擇性地對抗哇巴因誘發的動物室性心律失常，顯示其抗心律失常作用可能與抑制心肌Na^+內流作用有關。
- 大劑量小蘗鹼可抑制豚鼠心乳頭狀肌緩慢內向離子電流 (Isi)，顯示Ca^{2+}通道阻滯作用。

降血壓

- 小蘖鹼：
  - 靜脈給藥，對麻醉犬和清醒大鼠均能產生明顯的降血壓作用。
  - 降血壓同時伴後負荷和心率下降，而左室心肌收縮力加強，說明心率減慢及外周阻力降低是小蘖鹼降血壓作用的主要機制。

降血壓

- 小蘗鹼：
  - 利用大鼠肛尾肌標本及兔主動脈條標本，發現小蘗鹼0.3 umol/L、1.0 umol/L、3 umol/L可使去氧腎上腺素（α受體激動）引起的平滑肌收縮累積量效曲線平行右移，最大效應不變，顯示小蘗鹼對α受體有競爭性拮抗作用。
- 藥根鹼對麻醉、清醒大鼠及腎性高血壓大鼠亦有顯著的降血壓作用，其降血壓作用的機理也與α受體阻斷作用有關。

抗心肌缺血

- 小蘗鹼腹腔注射能顯著縮小大鼠冠脈結扎後24小時的心肌梗死範圍，抑制血清游離脂肪酸的增高，降低梗死後病理性Q波的發生率，對缺血性心肌具有保護作用。
- 應用體外培養心肌細胞技術，發現小劑量鹽酸小蘗鹼 (10 μg/mL)對缺氧性損害心肌細胞的搏動、乳酸脫氫酶釋放、細胞存活率、細胞超微架構均有較明顯的保護作用，而大劑量(30 μg/mL)鹽酸小蘗鹼則可加重缺氧引起的心肌細胞損害。

(2)抗腦缺血

- 採用鐳射多普勒流量儀動態監測軟腦膜微循環的變化，發現小蘗鹼能擴張麻醉小鼠腦膜血管，增加局部血流量。
- 小蘗鹼能提升動物缺血再灌流早期(120分鐘)海馬CA1區神經元內線粒體、粗面內質網和高爾基體對缺血的耐受性，減輕缺血再灌流晚期(7天)海馬CA1區遲發性神經元死亡程度，降低繼發性顛癇的發生率，對缺血再灌引起的腦組織損傷有明顯的保護作用。

(2)抗腦缺血

- 小蘗鹼抗腦缺血作用還與抗氧自由基作用及抑制缺血性損傷誘導的[Ca $^{2+}$]i異常有關。
  - 能顯著升高腦缺血時SOD、GSH-Px活力，降低丙二醛 (MDA)含量，
  - 對缺氧/缺糖誘導的神經細胞內游離鈣濃度([Ca^{2+}]i)的升高有明顯的抑制作用。

(3)抗血小板聚集

- 小蘗鹼：
  - 對ADP、花生四烯酸 (AA)、膠原II(COII) 及鈣離子載體(A23187)誘發的家兔血小板聚集和ATP釋放均有不同程度的抑制作用。
    - 以對膠原誘發的聚集和釋放作用抑制最為明顯。
  - 對正常入及血小板高聚集率患者，能使ADP和腎上腺素誘導的血小板聚集率降低。
  - 抗血小板聚集作用與升高血小板內cAMP濃度及Ca^{2+}拮抗作用有關。
  - 降血脂、抗缺氧、益智等作用。

綜述

- 黃連清熱燥濕、瀉火解毒功效與其抗病原體、抗內毒素、抗發炎、解熱、鎮靜催眠、降血糖、抗潰瘍、抗腫瘤等藥理作用有關。
- 黃連還具有顯著的心血管藥理活性，及抗腦缺血、抗血小板聚集等作用。
- 小蘗鹼是黃連的主要有效成分。

現代應用

- 感染性疾病：
  - 單味黃連及小蘗鹼治療細菌性痢疾。
  - 鹽酸小蘗鹼為治療痢疾腸炎的常用藥。
  - 黃連酒外用滴耳治療單純性中耳炎療效滿意。
  - 小蘗鹼口服治療衣原體或支原體引起的尿道炎，有一定療效。
  - 小蘗鹼口服治療慢性膽囊炎。

2. 心腦血管性疾病

- 小蘗鹼口服治療室性早搏和房性早搏。
- 小蘗鹼口服治療I-II期高血壓病有效。
- 鹽酸小蘗鹼(1200 mg/日)治療動脈硬化性腦梗塞患者，療效與阿司匹林(50 mg/日)相似。
- 小蘗鹼口服，治療高脂血症，療程8周，能降低TC，TG，提升HDL-C，作用與多烯康(Ethyl Polyenoate)、月見草油無顯著差別。

3. 糖尿病：小蘖鹼片口服治療II型糖尿病，降血糖作用可靠，病程短，療效好，無毒副作用。
4. 燒傷：將無菌敷料蘸黃連煎液覆蓋創面，治療II度燒傷。
5. 胃及十二指腸潰瘍、萎縮性胃炎：小蘖鹼口服有效。與vincomycin、ranitidine三聯治療幽門螺旋桿菌陽性十二指腸球部潰瘍，療效滿意。
6. 黃連複方還用於治療呼吸道感染、急性腎盂腎炎、焦慮症及失眠等。

不良反應

- 小蘗鹼口服給藥時毒性很小，大劑量(15mg/kg)靜脈注射可使麻醉兔出現心臟抑制。
- 以0.1%小蘗鹼給犬靜脈恆速滴注，小劑量時興奮心臟，滴注至180~270分鐘時，血壓下降，心臟抑制而死亡。
- 小鼠腹腔注射鹽酸小蘗鹼，半數致死量(LD_{50})為24.3 mg/kg，灌胃給藥LD_{50}為392 mg/kg。

- 黃連煎液和小蘗鹼溶液在超大劑量給藥時，葡萄糖-6-磷酸酶缺陷大鼠紅細胞滲透脆性有所增高，黃連煎液、小蘗鹼溶液作用相似而後者略弱。黃連與黃芩、甘草配伍應用可減輕此不良反應。
- 小蘗鹼口服治療心律失常，14患者可出現上腹部不適，便秘或腹瀉等胃腸道症狀，肝功能、血常規及尿常規均無異常改變。
- 口服小蘗鹼片或肌內注射小蘗鹼偶可引起過敏性反應，出現藥疹、皮炎、血小板減少症，曾有報道肌內注射出現過敏性休克。

下列何者不是黃連的藥理作用

A. 抗菌作用
B. 峻瀉作用
C. 抗發炎作用
D. 解熱作用

下列何者有和解退熱，疏肝解鬱？

A. 大黃
B. 地黃
C. 柴胡
D. 黃芩

苦參

- 豆科植物苦參*Sophora flavescens* Ait的乾燥根。
- 主要成分：生物鹼和黃酮類。
  - 現已分離出的生物鹼多達20餘種，
  - 目前認為具有藥理活性的5種主要生物鹼是苦參鹼 (matrine)、氧化苦參鹼 (Oxymatrine)、槐果鹼 (sophocarpine)、槐胺鹼 (sophoramine)及槐定鹼(sonhoridine)。

苦參

- 其他生物鹼：槐醇鹼 (Sophoranol)、N-甲基野靛鹼 (N-methylytisine)、臭豆鹼 (anagyrine)、贋靛葉鹼 (baptifoline)。
- 根中所含總黃酮量約為0.3%，進一步分離可得到二氫黃酮、黃酮醇和二氫黃酮醇。
- 有多種游離氨基酸、脂肪酸、蔗糖、芥子酸十六醋等。

- 味苦、性寒。歸心、肝、胃、大腸、膀胱經。

Sophora flavescens Ait.

與功效主治相關的藥理作用

苦參藥理作用

- 功效：清熱燥濕、殺虫、利尿。
- 主治：熱痢便血、黃疸、尿閉，赤白帶下，陰腫陰痒，濕疹，濕瘡，皮膚瘙癢，疥癬麻風。
- 神農本草經：主心腹氣結，癥瘕積聚，黃疸、溺有餘瀝，逐水，除癰腫。

(1)抗病原體

- 1%苦參鹼於體外對痢疾桿菌、大腸桿菌、變形桿菌、乙型溶血性鏈球菌及金黃色葡萄球菌均有明顯的抑制作用。
- 柯薩奇B3病毒對小鼠心肌有較強的毒性，苦參及苦參總鹼於體外對該病毒引起的細胞病變有抑制作用，於體內可抑制病毒在心肌中的增殖，延長感染小鼠存活時間。

(1)抗病原體

- 苦參1:3水煎液能抑制多種皮膚真菌的生長，如毛癬菌、黃癬菌、小芽胞癬菌和紅色表皮癬菌等。
- 苦參醇浸膏於體外能殺滅陰道滴虫，所需時間平均為58分鐘。

(2)抗發炎

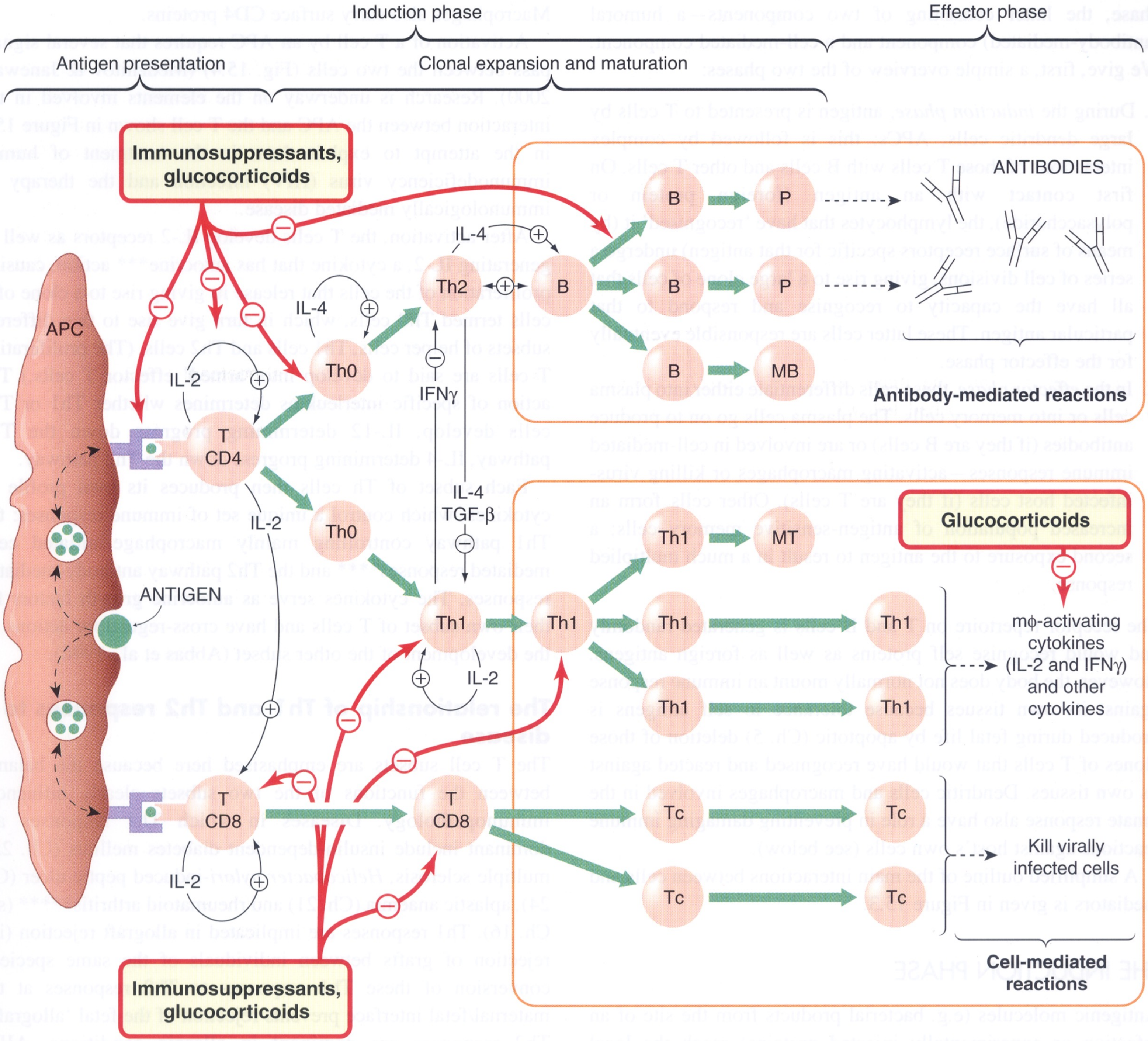
- 苦參水煎液及苦參鹼均有顯著的抗發炎作用。
- 苦參注射液、氧化苦參鹼腹腔注射，均能抑制大鼠蛋清性足腫脹。
- 苦參鹼：
  - 肌肉注射，可明顯對抗巴豆油誘發小鼠及大鼠耳殼腫脹性炎症，對角叉菜膠誘發的大鼠後肢腫脹、
  - 腹腔注射冰醋酸誘發的毛細血管通透性增加也有顯著的抑制作用。
  - 對大鼠棉球肉芽組織增生性炎症，或無明顯影響，或產生抑制作用，出現兩種不同報道。

(2)抗發炎

- 苦參鹼及氧化苦參鹼對正常小鼠以及摘除腎上腺小鼠，均能抑制因巴豆油和冰醋酸誘發的炎症，顯示苦參鹼的抗發炎作用與垂體-腎上腺系統無明顯關係。
- 苦參鹼能降低小鼠腹腔毛細血管通透性，抑制紅細胞的溶血現象，對細胞膜產生穩定作用，苦參的抗發炎作用可能與膜穩定作用有關。

(3)抗過敏

- 苦參有免疫抑制作用。
  - 對正常馬血清作為過敏原所致豚鼠過敏性休克，苦參液肌內注射可降低死亡率，由對照組之100%降低到61%，顯示抗1型過敏反應 作用。
- 苦參鹼對小鼠脾臟T細胞增殖有抑制作用，並抑制白血球介素2(IL-2)的生成或釋放。


Induction phase
Effector phase
Antigen presentation
Clonal expansion and maturation
Immunosuppressants, glucocorticoids
APC
ANTIGEN
IL-2
T CD4
Th0
IL-4
Th2
IL-4
B
IFNγ
IL-2
Th0
IL-4
TGF-β
Th1
IL-2
T CD8
IL-2
T CD8
Immunosuppressants, glucocorticoids
B
P
B
P
B
MB
ANTIBODIES
Antibody-mediated reactions
Th1
MT
Th1
Th1
Th1
Th1
Th1
Glucocorticoids
mϕ-activating cytokines (IL-2 and IFNγ) and other cytokines
Tc
Tc
Tc
Tc
Kill virally infected cells
Cell-mediated reactions

(3)抗過敏

- 氧化苦參鹼皮下注射，可顯著抑制小鼠腹腔巨噬細胞的吞噬能力。
- 比較5種生物鹼(苦參鹼、槐胺鹼、氧化苦參鹼、槐定鹼、槐果鹼)的免疫抑制作用，其中苦參鹼的免疫抑制作用較強，而槐果鹼作用較弱。

(4)抗腫瘤

- 多種苦參生物鹼對小鼠移植性腫瘤，均顯示有抗腫瘤作用，僅在作用強度和瘤株的選擇上有所差別。
- 對小鼠艾氏腹水癌，苦參鹼、脫氧苦參鹼、氧化苦參鹼和苦參總生物鹼均有較顯著的抑制作用，能延長荷瘤小鼠生存時間，其中氧化苦參鹼的作用最強。
- 苦參對小鼠肉瘤S_{180}、小鼠實體性子宮頸癌 (U14)也有不同程度的抑制作用。
- 苦參提取液作誘導分化劑，有促人紅白血病細胞株K_{562}向粒系和紅系分化成熟的作用。

(4)抗腫瘤

- 複方苦參水溶液體外對結腸癌細胞SW480有明顯的抑制作用，而且這種抑制作用呈現濃度和時間的倚賴性，光鏡及電鏡下可見胞核固縮，熒光染色增強，胞核碎裂，凋亡小體形成等凋亡形態學變化。
- 苦參及其成分抗腫瘤作用可能機制：
  - 誘導癌細胞凋亡;
  - 促進癌細胞分化;
  - 抑制癌細胞DNA合成;
  - 直接細胞毒作用。

(5)解熱：苦參注射液或氧化苦參鹼：

- 給家兔靜脈注射，對四聯菌苗引起的體溫升高有明顯的解熱作用，
- 給正常大鼠腹腔注射，可使體溫顯著降低，產生降溫作用。

(6)止瀉：

- 苦參主治熱痢便血，
- 苦參鹼灌胃能明顯延長灌服碳末小鼠黑便排出潛伏期，延緩蓖麻油性濕糞排出時間，減少小鼠排糞量，但對小鼠小腸推進功能未見明顯影響。

2.其他藥理作用

(1)抗心律失常

- 苦參總鹼：
  - 給大鼠靜脈注射，能顯著提升誘發心律失常及心臟停搏烏頭鹼用量，延遲心律失常發生的時間;使引起豚鼠室性心搏過速、心室纖顫及心臟停搏的哇巴因用量明顯高於對照組。
  - 對氯化鋇誘發的大鼠心律失常及氯仿、腎上腺素誘發的貓心室纖顫也有一定的對抗作用。

(1)抗心律失常

- 苦參鹼：
  - 靜脈注射能顯著對抗烏頭鹼、氯化鋇、結扎冠脈所致心律失常，使心率減慢，心電圖P-R及Q-T間期明顯延長。
  - 能減慢離體右心房自動頻率，使左房最大驅動頻率降低，抑制烏頭鹼、哇巴因和兒茶酚胺(腎上腺素、去甲腎上腺素、異丙腎上腺素)誘發的心房節律失常。

- 氧化苦參鹼對離體兔心房的興奮性無明顯影響，但能縮短功能不應期 (FRP)，減少右心房的自動節律，並使氯化鈣引起的正性頻率降低。
- 槐定鹼、槐胺鹼及槐果鹼也有抗實驗性心律失常作用，唯作用強度不如前者。
- 苦參鹼型生物鹼抗心律失常作用的電生理學基礎可能包括降低異位節律點自律性及消除折返衝動 (減慢傳導)。

- 苦參鹼及氧化苦參鹼能對抗兒茶酚胺引起的離體心房自律性增加，顯示其抗心律失常作用與β受體阻斷作用也有一定關係。
- 苦參鹼未顯示鈣拮抗作用。
- 苦參總黃酮也有抗實驗性心律失常作用。

(2)抗心肌缺血

- 苦參水煎醇沉液、苦參總鹼能減輕腦垂體後葉素引起的急性心肌缺血，抑制ST段下降和T波低平等心電圖缺血性變化。
- 苦參總鹼能對抗腦垂體後葉素引起的大和免冠脈流量降低，苦參注射液能使離體免耳灌流量明顯增加。
- 苦參抗心肌缺血作用可能與之擴張冠脈及外周血管，增加心肌血氧供應和降低心肌耗氧量有關。

(2)抗心肌缺血

- 苦參煎液、苦參總鹼、苦參鹼具有平喘作用;
- 苦參及苦參鹼有抗潰瘍作用;
- 苦參總鹼有鎮靜作用;
- 苦參注射液有保肝作用。

綜述

- 苦參清熱燥濕、殺虫等功效與其抗病原微生物、抗發炎、抗過敏、抗腫瘤、解熱、止瀉等藥理作用有關。
- 未見與其利尿功效相關的藥理作用報道。
- 苦參還具有顯著的抗心律失常、抗心肌缺血等作用。
- 主要有效成分是生物鹼。

現代應用

1. 急慢性腸炎：苦參流浸膏壓制成片，治療急性菌痢。
2. 滴虫性陰道炎：將苦參粉末與等量葡萄糖、硼酸粉及枯礬混合，陰道局部外用。
3. 皮膚病：苦參片、苦參總鹼、苦參注射液治療急慢性濕疹、藥物性剝脫性皮炎及肛門周遭皮膚炎(外用)。

4. 心律失常：苦參總鹼肌肉注射治療。
5. 腫瘤：複方苦參注射液配合化療治療惡性腫瘤病人。
6. 肝病：用苦參素注射液治療慢性乙型肝炎。
7. 苦參注射液治療慢性B型肝炎，降低血清谷丙轉氨酶和總膽紅素。

不良反應

- 苦參總鹼0.5~1.82 g/kg灌胃，小鼠出現間歇性抖動和痙攣，進而出現呼吸抑制，數分鐘後心跳停止。
- 苦參總鹼小鼠
  - 腹腔注射給藥的LD_{50}為147.2±14.8mg/kg，
  - 灌胃給藥LD_{50}為586.2±80.46 mg/kg;

不良反應

- 苦參鹼小鼠肌內注射的LD_{50}為74.15±6.14mg/kg;
- 氧化苦參鹼小鼠肌注LD_{50}為256.74±57.36mg/kg;
- 苦參總黃酮小鼠靜脈注射的LD_{50}為103.1±7.66 mg/kg。

- 亞急性毒性：
  - 苦參注射液，苦參混合生物鹼靜脈注射和腹腔注射，均未顯示明顯毒性作用，小鼠體重、血象和臟器基本正常。
  - 給犬肌內注射苦參結晶鹼0.5 g，每日1次，連續2周，多數動物出現食量減少，體重減輕，但肝、腎功能和血象無明顯毒性改變。

matrine具抗發炎、抗過敏及抗心律不整作用，為下列何者之活性成分

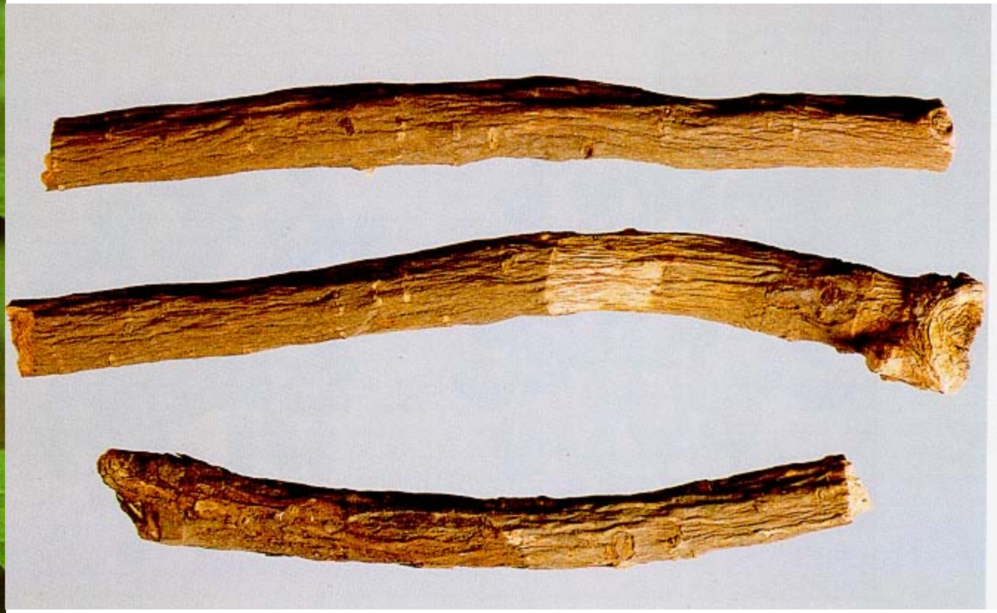
A. 牡丹皮
B. 苦參
C. 黃連
D. 黃耆

牡 丹 皮

- 毛茛科植物牡丹*Paeonia suffruticosa* Andr的乾燥根皮。
- 主要成分:
  - 牡丹酚 (丹皮酚，paeonol)、
  - 牡丹酚苷 (paeonoside)、
  - 牡丹酚原苷 (paeonolide)、
  - 芍藥苷 (Paeoniflorin)、
  - 苯甲酸芍藥苷 (benzoyl-paeoniflorin)、
  - 丹皮酚新苷 (apioaeonioside)。

牡丹皮

- 芍藥苷及牡丹酚原苷的含量最高，芍藥苷含量為0.91-2.5%。
- 沒食子酸 (gallic acid) 等。
- 味苦、辛，性微寒。歸心、肝、腎經。



與功效主治相關的藥理作用

- 功效：清熱涼血，活血化瘀。
- 主治：溫毒發斑，吐血衄血，夜熱早涼，無汗骨蒸，經閉痛經，癰腫瘡毒，跌仆傷痛。
- 本草經疏：其味苦而微辛，其氣寒而無毒。辛以散結聚，苦寒除血熱，入血分，涼血熱之要藥也。

(1)抗菌

- 牡丹皮提取物於體外對金黃色葡萄球菌、溶血性鏈球菌、肺炎球菌、枯草桿菌、大腸桿菌、傷寒桿菌、副傷寒桿菌、痢疾桿菌、變形桿菌、綠膿桿菌、百日咳桿菌及霍亂弧菌等有一定抑制作用，
- 對鐵鏽色小芽胞桿菌等10多種皮膚真菌也有一定抑制作用。

(2)抗發炎

- 牡丹皮對實驗性急性炎症及免疫性炎症有明顯對抗作用。
- 丹皮酚：
  - 小鼠腹腔注射，能顯著抑制由二甲苯所致耳廓腫脹。
  - 大鼠腹腔注射，對角叉菜膠、甲醛、新鮮蛋清及組織胺、5-HT和緩激肽(bradkynin)等炎性物質引起的大鼠足蹠腫脹有顯著抑制作用。

(2)抗發炎

- 丹皮酚磺酸鈉、牡丹皮甲醇提取物等對大鼠腫脹性關節炎有明顯抑制作用。
- 丹皮總苷對福氏完全佐劑性關節炎大鼠的原發性炎症反應和繼發性炎症反應均有明顯的抑制作用。

- 丹皮酚：
  - 對腹腔注射大腸桿菌內毒素引起的腹腔毛細血管通透性升高有顯著抑制作用，並能抑制炎性細胞游走，抑制炎性組織前列腺素合成，其抗發炎作用機理與此有關。
  - 對去腎上腺大鼠仍顯示顯著的抗發炎作用，對大鼠腎上腺維生素C含量也無明顯影響，
    - 因此認為丹皮酚的抗發炎作用與垂體-腎上腺系統無明顯關係。

(3)抗過敏及免疫調節作用

- 丹皮酚對實驗性I-IV型過敏反應 均有抑制作用。
  - 給豚鼠腹腔注射丹皮酚，連續5日，能對抗大鼠反向皮膚過敏反應 (RCA)及豚鼠Forssman抑皮膚血管炎反應，丹皮酚還能顯著抑制由牛血清白蛋白(BSA)誘導的大鼠Arthus型足距腫脹。
  - 丹皮酚連續給藥8日，能抑制二硝基氟苯 (DNFB)引起的遲發型小鼠耳廓接觸性皮炎。

(3)抗過敏及免疫調節作用

- 丹皮酚可增強單核巨噬細胞系統的功能，並能夠顯著增強外周血中性白血球對金黃色葡萄球菌的吞噬作用，從而增強機體非特異性免疫功能。
- 丹皮總苷在體外可明顯促進刀豆蛋白A (Con-A)誘導小鼠T淋巴細胞增殖反應和大鼠T淋巴細胞產生IL-2，還可促進脂多糖(LPS)誘導B淋巴細胞增殖反應，以及大鼠腹腔巨噬細胞產生IL-1。
- 顯示丹皮酚及總苷的促進特異性免疫功能作用。

- 丹皮酚對特異性免疫功能有抑制作用。
  - 丹皮酚能降低脾細胞溶血素抗體濃度，對免抗小鼠淋巴細胞血清 (ALS)誘導的小鼠淋巴細胞轉化和NK細胞活性都有顯著的抑制作用，並對Con-A和ALS誘導的小鼠脾淋巴細胞增殖亦有明顯抑制作用。
  - 丹皮酚腹腔注射，能顯著抑制補體經典途徑的溶血活性，但對旁路溶血活性無明顯影響。

(4)對中樞神經系統作用

- 牡丹皮清熱涼血，對中樞神經系統的抑制作用。
  1.鎮靜催眠抗驚厥：
    1)丹皮酚：
      - 可使小鼠自發活動減少，加大劑量能使翻正反射消失。
      - 給貓靜脈注射丹皮酚對電刺激腦乾網狀架構和丘腦下部引起的覺醒反應有抑制作用。
      - 抑制小腦皮質區和運動區的誘發電位。
      - 對電驚厥和戊四挫驚厥均有對抗作用，

(4)對中樞神經系統作用

- 牡丹皮清熱涼血，對中樞神經的抑制作用。
  1. 鎮靜催眠抗驚厥：
     1. 丹皮總苷灌胃：
        - 可延長戊四挫、士的寧所致小鼠驚厥的潛伏期及動物存活時間，
        - 增強苯巴比妥抗驚厥作用。

2. 鎮痛：

1. 丹皮酚磺酸鈉：

- 腹腔注射，給藥後30-90分鐘可提升小鼠痛閾(熱板法)，丹皮酚磺酸鈉、丹皮酚油劑均可使醋酸引起的小鼠扭體反應次數減少。
- 鎮痛作用無明顯耐受現象和藥物倚賴性。
- 鎮痛作用不被納絡酮翻轉。

3. 解熱和降溫：

1. 丹皮酚及丹皮酚磺酸鈉對三聯疫苗(霍亂、傷寒、副傷寒)引起的發熱均有解熱作用，並可使正常體溫降低。
2. 丹皮酚的解熱和降溫作用均比丹皮酚磺酸鈉強。

(5)對心腦血管系統作用

- 牡丹皮清熱涼血、活血化瘀，具有多種心腦血管系統藥理作用。
  1. 抑制血小板聚集：
     1. 牡丹皮提取物能顯著抑制ADP、膠原和腎上腺素誘導的健康人血小板聚集，明顯減少血栓素A2(TXA2)的生成。
     2. 丹皮酚體內和體外均能抑制凝血酶誘導的血小板聚集，並能抑制凝血酶誘導的大鼠血小板5-HT釋放，呈量效關係。

(5)對心腦血管系統作用

2. 改善血液流變學：
   1. 丹皮酚可降低大鼠全血表觀黏度、使紅細胞壓積降低，同時降低紅細胞聚集性和血小板黏附性，使紅細胞的變形能力顯著增強。
3. 抗心肌缺血：
   1. 牡丹皮水煎醇沉提取液或其粉針劑靜脈注射，可明顯改善因結扎冠脈引起的心外膜電圖缺血改變，並能降低心肌耗氧量、增加冠脈流量和降低心輸出量。

4. 抗腦缺血：
    1. 丹皮酚對大鼠反覆性短暫腦缺血再灌注所致腦損傷具有保護作用，並可降低沙土鼠腦缺血再灌注後炎性反應。
5. 抗動脈粥狀硬化：丹皮酚
    1. 可顯著抑制高脂飼料所致實驗性動脈粥狀硬化斑塊形成，但對血清膽固醇(TC)含量影響不明顯。
    2. 可明顯降低鵪鶉血清TC、甘油三酯(TG)、低密度脂蛋白(LDL)、極低密度脂蛋白(VLDL)等含量，提升高密度脂蛋白(HDL)含量，抑制主動脈脂質斑塊形成。

2.其他藥理作用

1) 保肝：丹皮總苷：

- 對CCl4和氨基半乳糖所致小鼠化學性肝損傷有保護作用，可降低血清ALT、AST，減輕肝細胞變性和壞死程度。
- 有促進小鼠肝臟糖原合成和提升血清蛋白含量的作用，可明顯降低肝勻漿脂質過氧化產物MDA的含量，提升血清和肝臟谷胱甘肽過氧化物酶活力。

2.其他藥理作用

2) 利尿：丹皮酚
- 灌胃可使大鼠尿量增加，尿中Na^+和Cl^-的排泄隨用藥劑量的增加而增加。
- 還能升高血漿滲透壓，可能與其利尿作用有關。

3) 降血糖：丹皮多糖粗品灌胃給藥可使正常小鼠血糖顯著降低，加大劑量對葡萄糖誘發的小鼠高血糖也有顯著降低作用。

4) 牡丹皮還有抗腫瘤、抗早孕、降血壓、抗心律失常等作用。

綜述

- 牡丹皮清熱涼血功效以其抗菌、抗發炎、抗過敏、鎮靜催眠抗驚厥、鎮痛、解熱等藥理作用為基礎，
- 活血化瘀功效與其抗血小板聚集、改變血液流變學、抗心腦缺血、抗動脈粥狀硬化作用有關。
- 主要有效成分是丹皮酚。

現代應用

1. 皮膚病：5%丹皮酚霜外用治療濕疹類皮膚病和皮膚瘙癢症。丹皮酚注射液肌注治療慢性濕疹、皮膚瘙癢症、神經性皮炎等也有效。
2. 原發性高血壓： 複方丹皮片由丹皮浸膏加入丹皮酚及珍珠粉組成。
3. 其他：含牡丹皮的大黃牡丹皮湯治療多種婦科疾病，如產後發熱，帶下，陰痒，盆腔膿腫，術後盆腔感染等，均取得了較好療效。
4. 大黃牡丹皮湯加味治療肺癰、喉癰、肛門膿腫、血栓性外痔等，也有一定療效。

不良反應

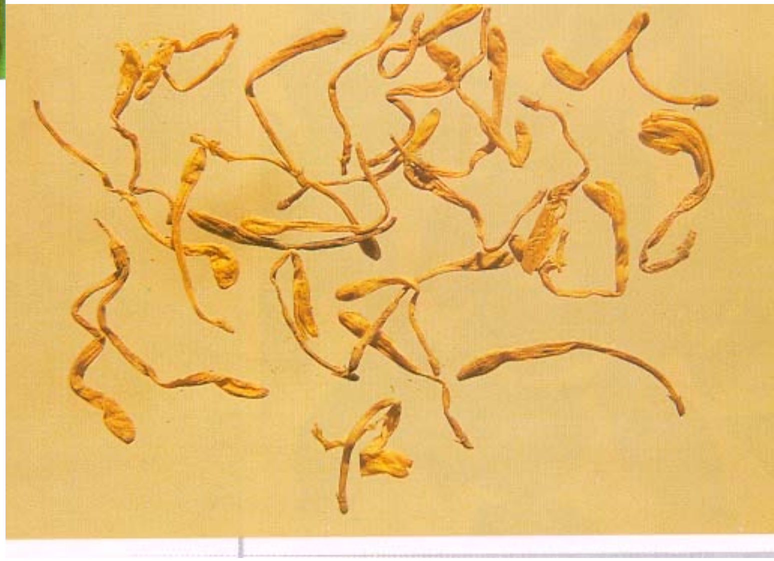
- 丹皮酚50花生油劑給小鼠灌胃，測得LD_{50}為4.9±0.47 g/kg,腹腔注射的LD_{50}為735 mg/kg。
- 丹皮酚磺酸鈉小鼠腹腔注射的LD_{50}為6.9 g/kg。
- 大鼠腹腔注射丹皮酚磺酸鈉250 mg/kg, 500 mg/kg, 750 mg/kg，共30日，對肝腎功能均無明顯影響，各臟器無異常病理改變，大劑量組胃黏膜出現水腫，但無潰瘍發生。

丹皮酚(paeonol)可從下列哪一個中藥分離得到，具有抗發炎及解熱降溫作用？

A. 黃芩
B. 玄參
C. 牡丹皮
D. 梔子

金銀花

- 為忍冬科植物忍冬*Lonicera japonica* Thunb. 的花蕾。
- 主要化學成分：綠原酸 (chorogenic acid)和異綠原酸 (isochorogenic acid)。
- 黃酮類化合物如木犀草素 (luteolin)、木犀草素-7-葡萄糖苷、忍冬苷，肌醇、揮發油、皂苷等。
- 味甘，性寒。歸肺、胃、大腸經。



與功效主治相關的藥理作用

- 功效：清熱解毒。
- 主治：外感發熱、瘡癰瘰腫、熱毒瀉痢。
- 本草綱目：一切風濕氣，及諸腫毒、癰疽、疥癬、楊梅諸惡瘡，散熱解毒。

(1)抗病原微生物

- 具有廣譜抗菌作用。
- 在體外對多種革蘭陽性菌如金黃色葡萄球菌、溶血性鏈球菌、肺炎球菌，革蘭陰性菌如痢疾桿菌、大腸桿菌、傷寒桿菌、百日咳桿菌、綠膿桿菌、腦膜炎雙球菌、淋球菌等有不同程度的抑制作用，對結核桿菌也等有一定的抑制作用。
- 於體內也有抗菌作用，能降低綠膿桿菌感染小鼠死亡率，減輕大腸桿菌引起的實驗性腹膜炎。

(1)抗病原微生物

- 與連翹、青黴素等合用，抗菌作用互補或增強。
- 綠原酸和異綠原酸是金銀花重要的抗菌成分，黃酮類及揮發油也可能有一定抗菌活性。
- 金銀花水提物於體內及體外均有明顯的抗病毒活性。
- 體外實驗顯示金銀花能抑制流感病毒京科68-1株、孤兒病毒ECHO11、單純疱疹病毒等所致細胞病變，體內給藥能提升動物抗病毒感染能力，減輕炎症反應，降低死亡率。

2) 抗內毒素：

1) 細菌釋放的內毒素入血後可引起全身毒血症狀，出現發熱、頭痛，白血球增多等。

2) 金銀花可減少內毒素引起的小鼠死亡數，對內毒素引起的發熱有解熱作用，並加速內毒素從血中清除。

3) 抗發炎：

1) 金銀花對角叉菜膠和新鮮雞蛋清引起的大鼠足蹠腫脹有明顯抑制作用，對大鼠巴豆油性肉芽囊腫也有抑制作用，能減少炎性滲出和肉芽增生。

4) 解熱：金銀花及其複方製劑銀翹散、銀黃注射液等具有一定解熱作用。

5) 提升免疫功能：

1) 金銀花能提升小鼠腹腔炎性細胞及外周血白血球的吞噬能力，增加小鼠血清溶菌酶的活性，從而提升機體的非特異性免疫功能。

2. 其他藥理作用

- 金銀花有效成分綠原酸類化合物有明顯的利膽作用;
- 金銀花煎劑可降低膽固醇，減少膽固醇在腸道的吸收;
- 綠原酸能縮短凝血及出血時間，有止血作用;
- 金銀花醇提物對小鼠、犬、猴等均有抗早孕作用。
- 金銀花水及醇浸液對肉瘤和艾氏腹水癌有一定的細胞毒作用。

綜述

- 金銀花清熱解毒功效與抗病原微生物、抗內毒素、抗發炎、解熱及提升機體免疫功能有關。
- 綠原酸及異綠原酸是其主要有效成分。

現代應用

1. 急性上呼吸道感染：金銀花及其多種複方製劑廣泛用於治療感冒、流感、上呼吸道感染。
2. 小兒肺炎：金銀花注射液或與黃芩配伍，治療小兒肺炎。
3. 急性扁桃體炎：金銀花注射液使體溫較快下降，局部紅腫滲出等炎症反應消退。

不良反應

- 金銀花注射液可引起過敏性休克，銀黃注射液也可引起過敏反應，因此使用含金銀花的注射劑應注意過敏反應。
- 金銀花水浸劑口服，未見對實驗動物呼吸、血壓、尿量等有明顯影響，顯示無明顯毒性。
- 幼年大鼠灌服綠原酸的LD50大於1 g/kg，腹腔注射大於0.25 g/kg。

大青葉與板藍根

- 大青葉為十字花科植物菘藍 (*Isatis indigotica* Fort.)的乾燥葉。
- 板藍根為菘藍的根。
- 大青葉的主要化學成分有菘藍苷 (大青素B，isatan B)、靛藍 (Indigo)、靛玉紅 (Indirubin)、色胺酮 (tryptanthrin)，及揮發油等。
- 靛藍 (Indigo)為菘藍苷的水解產物。
- 板藍根主要化學成分為靛藍、靛玉紅，但不及大青葉含量高，另含多糖等。
- 大青葉與板藍根味苦，性寒。歸心、胃經。，

大青葉

板藍根

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：清熱解毒、涼血消斑。
- 主治：熱毒入血，發斑神昏，咽喉腫痛，丹毒口瘡。
- 本草正：治溫疫熱毒發狂，風熱斑疹，癰瘍腫痛，除煩渴。
- 止鼻衄、吐血，凡以熱兼毒者，皆宜葉搗汁用之。

(1)抗病原微生物

- 大青葉對多種細菌如金黃色葡萄球菌、肺炎球菌、鏈球菌、白喉桿菌，以及傷寒桿菌、大腸桿菌、流感桿菌、痢疾桿菌等均有抑制作用。還能抑制乙型腦炎病毒、腮腺炎病毒及鉤端螺旋體等。
- 色胺酮對多種致病性皮膚真菌有抑制作用。
- 板藍根對細菌、病毒、鉤端螺旋體、真菌等多種病原微生物有抑制作用。

(1)抗病原微生物

- 板藍根抗病毒作用比較顯著，於體外或體內對多種病毒均有抑制作用，如能抑制流感病毒增殖，延緩流感病毒、腺病毒對入胚腎原代單層上皮細胞的損傷作用。
- 板藍根注射液於體外對出血熱腎病綜合征病毒有殺滅作用。
- 板藍根穴位注射對B型肝炎病毒表面抗原攜帶者，可促進HBsAg、HBeAg轉陰。靛藍、靛玉紅可能是其抗病原微生物的有效成分。

(2)提升機體免疫功能

- 板藍根多糖腹腔注射能明顯提升小鼠免疫功能:

1. 增加正常小鼠脾臟重量，並可對抗氫化可的松(hydrocortisol)所致脾臟萎縮，但對胸腺無明顯影響;
2. 增加正常小鼠外周血白血球、淋巴細胞數及ANAE陽性淋巴細胞數，並可對抗氫化可的鬆的抑制作用;
3. 提高網狀內皮系統的吞噬能力，促進炭粒廓清;
4. 促進溶血素抗體生成;
5. 增強二硝基氟苯誘導的小鼠遲發型過敏反應 等。

(3)保肝

- 大青葉與板藍根具有顯著的保肝作用，
- 靛藍混懸液灌胃對四氯化碳引起的動物肝損傷有明顯保護作用，
- 板藍根穴位注射對Ｂ型肝炎病毒表面抗原攜帶者，可促進HB-sAg、HB-eAg轉陰。

2. 其他藥理作用

- 板藍根注射液及靛玉紅有抗白血病作用;
- 板藍根多糖灌胃，對實驗性高脂血症大鼠有降低膽固醇和甘油三酯作用。

綜述

- 大青葉與板藍根清熱解毒、涼血消斑功效，主要與抗病原微生物、提升機體免疫功能、保肝等藥理作用有關。
- 靛藍、靛玉紅是其主要有效成分。

現代應用

1. 上呼吸道感染：大青葉和板藍根是治療上呼吸道感染的常用中藥。板藍根對病毒性感冒尤為常用，退熱效果顯著。
2. 扁桃體炎、咽炎：板藍根沖劑治療慢性濾泡性咽炎、乾燥性咽炎、慢性扁桃體炎。
3. 急性傳染性肝炎：大青葉煎劑、板藍根各種製劑均為常用，能明顯緩解症狀，促進肝功能好轉。

4. 流行性乙型腦炎及流行性腦脊髓膜炎：大青葉、板藍根，或與其他清熱藥配伍應用，可使體溫下降、症狀改善。

5. 大青葉與板藍根及各種板藍根製劑：常用於帶狀皰疹、單純皰疹、皰疹性口腔炎等病毒感染性疾病。

穿心蓮

- 爵床科一年生草本植物穿心蓮*Andrographis paniculata* (Burm. F.) Nees的全草。
- 主要化學成分為內酯、內酯苷及黃酮類化合物。
- 味苦，性寒。歸肺、胃、大腸、小腸經。

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：清熱解毒、燥濕。
- 主治：發熱頭痛、肺熱喘咳、咽喉腫痛，以及濕熱瀉痢、熱淋、濕疹。

(1)抗病原微生物

- 穿心蓮常用於腸炎痢疾以及呼吸道感染，有明顯的臨床療效，但抗菌作用的實驗研究至今尚未有明確的結果。
- 臨床用於治療痢疾，穿心蓮內酯的作用比黃酮成分效果顯著，但穿心蓮內酯於體外未見其具有抗痢疾桿菌、肺炎桿菌、金黃色葡萄球菌等作用。
- 穿心蓮抗感染作用可能與其提升機體非特異性免疫功能、解熱、抗發炎等其他作用有關。

(2)抗發炎

- 穿心蓮內酯甲、乙、丙、丁素單體物，對化學藥物引起的小鼠耳腫脹、大鼠足蹠腫脹等急性滲出性炎症有顯著的對抗作用，並能降低毛細血管通透性，但對肉芽組織增生無明顯影響，其中穿心蓮丁素作用最強。
- 穿心蓮抗發炎作用可能與興奮垂體-腎上腺皮質系統功能有關。

(3)對免疫功能影響

- 含穿心蓮內酯及黃酮類化合物的穿心蓮注射液肌肉注射，能明顯增強小鼠腹腔巨噬細胞及外周血中性粒細胞吞噬金黃色葡萄球菌及白色念珠菌的能力，並能提升外周血溶菌酶活性，顯示增強機體非特異性免疫功能作用。
- 穿心蓮內酯灌胃給藥能抑制網狀內皮系統的吞噬功能，使小鼠胸腺萎縮，顯示免疫抑制作用。
- 不同給藥途徑似乎對穿心蓮的作用有較大影響。
- 對特異性免疫功能，不同製劑的作用也不相同。

3. 解熱：穿心蓮甲、乙、丙、丁素對家兔因傷寒、副傷寒菌苗引起的發熱有顯著的解熱作用，對2，4-二硝基酚引起的大鼠發熱也有解熱作用，且丁素作用最明顯。

4. 抗腫瘤：穿心蓮內酯及某些衍生物，對多種實驗性移植性腫瘤有抑制作用，穿心蓮黃酮本身雖無抗腫瘤作用，但能增強環磷醯胺的抗腫瘤作用。

5. 抗蛇毒：穿心蓮有抗蛇毒作用，其乙醇提取物能延長中毒小鼠呼吸衰竭和死亡發生的時間。

2. 其他藥理作用

1. 抗血小板聚集：穿心蓮水提物能抑制ADP誘導的血小板聚集，有效成分是黃酮部分，內酯部分無明顯活性。
2. 抗心肌缺血：犬冠脈左前降支阻斷後再灌注致心肌損傷，穿心蓮提取物靜脈注射對此有明顯保護作用，能降低心肌細胞內Na^{+}、Ca^{2+}含量，增加K^{+}、Mg^{2+}含量及K^{+}/Na^{+}比值，減少心律失常的發生率。
   1) 穿心蓮抗心肌缺血再灌注損傷作用可能與其抗氧化作用有關。

3. 保肝利膽：穿心蓮內酯對多種實驗性化學性肝損傷有保護作用，降低血清ALT和AST。穿心蓮內酯能明顯促進大鼠及豚鼠膽汁分泌，增加膽酸和膽鹽的排泄。

4. 終止妊娠：穿心蓮各種提取物靜脈注射、腹腔注射、宮內注射，均能終止妊娠，此一作用可能與其抗孕激素及直接損傷胎盤絨毛滋養層細胞有關。

綜述

- 穿心蓮清熱解毒、燥濕功效以抗菌、抗發炎、增強免疫、解熱及抗毒等藥理作用為基礎。
- 主要有效成分是穿心蓮內酯。

現代應用

1. 腸道感染：
   1. 穿心蓮常用於治療急性腸炎痢疾，療效明顯。
   2. 製劑有穿心蓮總內酯片、穿心蓮乙素片及穿心蓮甲素注射液等。
2. 呼吸道感染：
   1. 穿心蓮多種製劑是治療上呼吸道感染的常用中藥。
   2. 穿心蓮甲素注射液對急性扁桃體炎、肺炎也有一定療效。
   3. 穿琥寧注射液(脫水穿心蓮內酯琥珀酸半酯)對病毒性肺炎及上呼吸道感染療效顯著。

3. 絨毛膜上皮癌及惡性葡萄胎：穿心蓮注射對絨毛膜上皮癌及惡性葡萄胎有一定療效。
4. 濕疹及蕁麻疹：穿心蓮內酯注射液治療濕疹、頑固性亨麻疹有效，也用於治療神經性皮炎、帶狀疱疹等皮膚病。

不良反應

- 穿心蓮味苦，口服可引起胃部不適、食慾減退等症狀。
- 穿心蓮內酯大劑量口服，連續4日，可引起血清ALT升高，停藥後可恢復正常。
- 穿心蓮總內酯灌胃給藥的LD50為13.4g/kg，穿心蓮甲、乙、丙、丁素灌胃給藥的LD50均超過20 g/kg，毒性較低。

牛黃

- 為牛科動物黃牛*Bostaurus domesticus* Gmelin的膽囊結石。
- 由牛膽汁或豬膽汁經提取加工而成的稱人工牛黃，用作天然牛黃的代用品。
- 天然牛黃的主要化學成分是膽酸、去氧膽酸、膽紅素、牛磺酸、膽固醇、麥角固醇、卵磷脂等，其中膽紅素含量高達40%以上。
- 牛黃中還含有2種平滑肌收縮物質 (SMC)。
- 味苦，性涼。歸肝、心經。

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：清熱解毒，息風止痙，化痰開竅。
- 主治：溫熱病及小兒驚風、壯熱神昏、痙攣抽搐;痰熱阻閉心竅所致神昏;熱毒鬱結所致咽喉腫痛、口舌生瘡、癰疽療毒等証。
- 本經：主驚癇寒熱，熱盛狂痙。
- 名醫別錄：療小兒百病，諸癇熱，口不開，大人狂癲，又墮胎。

1. 抗病毒：牛黃對乙腦病毒有直接滅活作用，天然牛黃作用比人工牛黃作用強，含膽紅素製劑比不含者作用強。

2. 抗發炎：牛黃對實驗性急性和慢性炎症均有抑制作用，能減輕二甲苯致小鼠耳腫脹及蛋清致大鼠足蹠腫脹，且能降低醋酸所致小鼠腹腔毛細血管通透性增加，抑制多形核細胞游走。對大鼠甲醛濾紙性肉芽組織增生及小鼠棉球肉芽腫均有較強的抑制作用。

(3)解熱

- 牛黃具有解熱和降溫作用，能降低酵母和2，4-二硝基酚所致發熱大鼠體溫，且能降低正常大鼠體溫。
- 牛磺酸是牛黃解熱作用的有效成分之一，關於其解熱作用機理:認為牛磺酸可能是一種發熱反應的抑制性介質等。

(4)鎮靜抗驚厥

- 天然牛黃口服能減少小鼠的自主活動，對抗咖啡因引起的中樞興奮，並能協同戊巴比妥鈉的催眠作用，延長小鼠睡眠時間。
- 天然牛黃可對抗咖啡因、印防己毒(picrotoxin)、戊四氮(pentylentetrazol)等引起的小鼠驚厥，延長驚厥潛伏期。

(4)鎮靜抗驚厥

- 牛黃對士的寧(strychnine)性驚厥無明顯對抗作用，顯示牛黃作用部位不在脊髓而在腦幹和皮層。
- 牛磺酸是牛黃中樞抑制作用的有效成分，對皮層、腦幹、脊髓均有一定抑制作用，目前認為牛磺酸可能是一種中樞抑制性氨基酸。

5. 降血壓：

1. 牛黃口服對自發性高血壓大鼠及腎性高血壓大鼠，均可產生顯著而持久的降血壓作用。
2. 去氧膽酸、膽紅素、牛磺酸、SMS等也有不同程度的降血壓作用。
3. 牛黃及其成分降血壓作用機制：擴張血管、抗腎上腺素作用有關，也可能是中樞性降血壓作用。

6. 鎮咳祛痰平喘：牛黃、膽酸、去氧膽酸鈉等有一定鎮咳祛痰平喘作用。

2.其他藥理作用

1. 強心：牛黃、牛膽酸、牛磺酸等均能明顯加強離體蛙心、豚鼠心、貓心乳頭狀肌收縮力，而膽紅素卻抑制心臟。牛磺酸可能是牛黃強心的主要有效成分。
2. 利膽解痙：牛黃利膽作用顯著，其水提液灌胃可使大鼠膽汁分泌增加，並鬆弛奧狄氏括約肌。牛黃水提液及去氧膽酸鈉等可對抗乙醯膽鹼所致離體腸管收縮，顯示解痙作用。但牛黃中還存在兩種收縮胃腸平滑肌的酸性肽類物質，即SMC-S2和SMC－F。
3. 牛黃尚有抑制血小板聚集、促進紅細胞生成、保肝、鎮痛及抑制腫瘤等作用。

綜述

1. 牛黃清熱解毒，息風止痙，化痰開竅功效與抗病毒、抗發炎、解熱、鎮靜抗驚厥、降血壓、鎮咳祛痰等藥理作用有關。

現代應用

1. 高熱驚厥：治療小兒高熱驚厥、急性感染性疾病高熱驚厥、乙型腦炎、肝性腦病及肺性腦病昏迷驚厥等。牛黃製劑也用於中風昏迷。
2. 急性呼吸道感染：牛黃製劑常用於治療流感、上呼吸道感染及肺炎等。

不良反應

- 常用牛黃製劑牛黃解毒片、牛黃解毒丸、牛黃上清丸等均有一些不良反應，如過敏反應、消化道出血、血小板減少等，使用時應注意。
- 天然牛黃小鼠灌胃LD_{50}超過15 g/kg，腹腔注射LD_{50}為675.8±152.1 mg//kg。
- 小鼠口服膽酸、去氧膽酸的LD_{50}分別為1.52 g/kg和1.06 g/kg。

魚腥草

- 三白草科植物蕺菜Houttuynia Cordata Thunb.的全草。
- 主要化學成分：揮發油和黃酮。
  - 揮發油成分含癸醯乙醛 (魚腥草素，decanoylacetaldehyde)及月桂醛 (lauraldehyde)等，魚腥草的特殊氣味與癸醯乙醛有關。
    - 癸醯乙醛性質不穩定，易聚合，人工合成了其亞硫酸氫鈉加成物，即合成魚腥草素。
  - 黃酮類有槲皮素 (qercetin)、異槲皮素、槲皮苷等。
- 大量鉀鹽、綠原酸等。
- 味辛，性微寒。歸肺經。

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：清熱解毒，消癰排膿，利尿通淋。
- 主治：肺癰咳吐膿血，肺熱咳嗽，熱毒瘡瘍，熱淋等。
- 本草經疏：治痰熱壅肺，發肺癰為吐膿血之要藥。

(1)抗病原微生物

- 具有廣譜抗菌作用。
- 在體外對多種革蘭陽性菌如金黃色葡萄球菌、溶血性鏈球菌、肺炎球菌、白喉桿菌;革蘭陰性菌如變形桿菌、痢疾桿菌、豬霍亂弧菌等有不同程度的抑制作用。
- 對結核桿菌等也有一定的抑制作用。
- 魚腥草素是魚腥草中具有抗菌活性的主要成分。

- 合成魚腥草素:
  - 對金黃色葡萄球菌，包括耐青黴素菌株，以及肺炎球菌、甲型鏈球菌、流感桿菌抑制作用較強，卡他球菌、傷寒桿菌其次，而對痢疾桿菌、大腸桿菌、綠膿桿菌等，則抑制作用不明顯。
  - 不僅體外具有抗結核桿菌作用，而且體內給藥能明顯延長感染結核菌小鼠的存活時間。
  - 抗真菌作用，於體外能抑制白色念珠菌、多種致病性皮膚癬菌的生長。
- 魚腥草還有明顯的抗流感病毒京科68-1株、孤兒病毒ECHO11活性，且對鉤端螺旋體也有一定抑制作用。

(2)抗發炎

- 魚腥草煎劑對大鼠甲醛性足蹠腫脹有抑制作用。
- 魚腥草素是其抗發炎有效成分之一，能抑制巴豆油和二甲苯引起的小鼠耳腫脹及皮膚毛細血管通透性增加，以及醋酸引起的小鼠腹腔毛細血管通透性增加。
- 黃酮成分槲皮素、槲皮苷等也具有抗發炎活性。

(3)對免疫功能的影響

- 魚腥草水煎劑於體外能明顯增強人外周血中性粒細胞吞噬金黃色葡萄球菌的能力，
- 魚腥草注射液皮下注射，能明顯增加大鼠外周血ANAE陽性淋巴細胞百分率。
- 魚腥草提取物霧化吸入，能顯著增加大鼠肺巨噬細胞的吞噬率，以及外周血ANAE陽性淋巴細胞百分率。
- 合成魚腥草素可提升慢性氣管炎病患全血白血球對白色葡萄球菌的吞噬能力，及血清備解素濃度。
- 魚腥草清熱解毒、消癰排膿功效與提升機體非特異性免疫功能有關。

- 魚腥草又具有抗過敏作用。
  - 魚腥草揮發油於體外能抑制卵白蛋白致敏豚鼠離體回腸收縮的幅度，連續皮下注射4日，對噴霧卵白蛋白所致豚鼠過敏性哮喘有明顯的對抗作用;
  - 對慢反應物質 (SRA-A)引起的豚鼠離體回腸收縮、豚鼠肺溢流增加，也有抑制作用。
  - 魚腥草油還能抑制組織胺、乙醯膽鹼引起的過敏反應。
  - 抗過敏作用可能包括：
    - 抑制過敏介質釋放、
    - 對抗過敏介質作用
    - 直接鬆弛平滑肌。

2. 其他藥理作用

- 魚腥草及合成魚腥草素還有不同程度的抗內毒素、抗癌、利尿作用。

綜述

- 魚腥草清熱解毒、消癰排膿、利尿排淋功效，主要與抗病原微生物、抗發炎、對免疫功能影響等藥理作用有關。
- 主要有效成分是魚腥草素。

現代應用

1. 急性呼吸道感染：魚腥草對急性支氣管炎、支氣管肺炎、大葉性肺炎、肺膿瘍等均有較好療效。
2. 婦科炎症及不孕症：魚腥草水液、合成魚腥草素對子宮頸炎、盆腔炎等有一定療效。
3. 常用於治療外科術後感染、皮膚病、細菌性痢疾等。

不良反應

- 魚腥草口服毒性較小，但有魚腥臭味，有刺激性，肌內注射可引起疼痛，陰道給藥可引起黏膜充血。
- 魚腥草煎劑小鼠腹腔注射的LD50為51.04 g/kg。
- 合成魚腥草素的毒性較粗製劑大，給小鼠灌胃的LD50是1.6 g/kg。

不良反應

- 靜脈注射低劑量合成魚腥草素75-90 mg/kg，連續給藥7日，雖未引起小鼠死亡，但給藥初期，小鼠出現運動失調、痙攣，繼續給藥症狀消失;
- 犬每日口服80 mg/kg或160 mg/kg，連續30日，對食慾、血象及肝腎功能均無明顯影響，但可引起流涎和嘔吐。

知母

- 為百合科植物知母*Anemmhena asphodeloides* Bge.的乾燥根莖。
- 根莖主含多種甾體皂苷 (約含6%)。其中含有知母皂苷 (timosaponin)A-I、A-II、A-III、A-IV、B-I及B-II。皂苷元主要為菝契皂苷元 (sarsasaponin)。
- 黃酮類，如芒果苷(mangiferin)、異芒果苷(isonmangiferin)和知母聚糖 (anemarens)A、B、C、D。
- 味苦、甘，性寒。歸肺、胃、腎經。

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：清熱瀉火，生津潤燥。
- 主治：外感熱病，高熱煩渴，肺熱燥咳，骨蒸潮熱，內熱消渴，腸燥便秘。
- 本草綱目：知母之辛苦寒涼，下則潤腎燥而滋陰，上則清肺金而瀉火。
- 本草新編：知母瀉腎中之熱，亦瀉胃中之熱。
- 本經：主消渴熱中。

(1)抗病原微生物

- 體外試驗，知母對傷寒桿菌、痢疾桿菌、白喉桿菌、金黄色葡萄球菌、肺炎雙球菌等有一定抑制作用。
- 知母乙醇、乙醚等提取物對結核桿菌H37RV有較強的抑制作用，而皂苷無作用。
- 對於小鼠實驗性結核桿菌感染，飼以含知母的飼料可使肺部病變有所減輕。
- 芒果苷是其抗結核桿菌的有效成分之一。
- 知母對某些致病性皮膚真菌及白色念珠菌也有不同程度的抑制作用。
- 異芒果苷及芒果苷均具有顯著的抗單純疱疹病毒作用，可阻止HSV-1在細胞內的復製。

(2)解熱

- 知母皮下注射對大腸桿菌所致的家兔高熱有明顯的預防和治療作用。其解熱特點是慢而持久。
- 解熱機理與抑制產熱過程有關，透過抑制與產熱有關的細胞膜上Na^+，K^+--ATP酶，使產熱減少。
- 整體試驗中給予甲狀腺素可致大鼠肝、腎及小腸黏膜Na^+，K^+-ATP酶顯著升高，同時灌服菝契皂苷元25mg/只，可使其恢復正常濃度。
- 由於鈉幫浦在腸黏膜上皮及腎曲小管中均能促進水分吸收，鈉幫浦活性過高可引起產熱增加，大便乾結，尿短赤等而與陰虛內熱証相符，故認為知母滋陰清熱功效與其抑制鈉活性，使產熱減少有關。
- 知母解熱的主要有效成分是菝契皂苷元、知母皂苷。

(3)抗發炎

- 知母所含芒果苷有顯著抗發炎作用，50 mg/kg灌胃或腹腔注射，對角叉菜膠所致大鼠足蹠水腫及棉球肉芽腫有顯著抑制作用。

(4)對交感神經和β受體功能的影響

- 臨床上陰虛病患多有多巴胺-β-烴化酶活性增強、β受體-cAMP系統功能偏亢的現象。
- 知母及其皂苷元
  - 能使血、腦、腎上腺中多巴胺-β-烴化酶活性降低，NA合成和釋放減少;
  - 能抑制過快的β受體蛋白質合成，下調過多的β受體;
  - 能使陰虛模型動物腦、腎中自受體功能下降，血中cAMP含量減少;
  - 從而導致交感神經和β受體功能降低。
- 知母還能調節失調的β受體和M受體功能，使之恢復正常。

(5)降血糖

- 知母水提物和多糖對正常家兔有降血糖作用，對四氧嘧啶(alloxan)糖尿病家兔和小鼠及胰島素抗血清所致糖尿病鼠有更明顯的降血糖作用，並可使小鼠尿中酮體減少。
- 知母對正常大鼠葡萄糖氧化元促進作用，但能促進橫膈、脂肪組織對葡萄糖的攝取，使橫膈中糖原含量增加，但肝糖原含量下降，
- 知母降血糖的有效成分為知母聚糖A、B、C、D，以B活性最強。

2.其他藥理作用

(1)改善學習記憶

- 知母和知母皂苷元能透過提升衰老早期小鼠腦內相對減慢的M-受體的合成，從而提升腦M-受體數量，改善其學習記憶能力。
- 知母皂苷元也能促進老年大鼠學習記憶能力。但對東浪菪鹼所致青年小鼠記憶障礙卻無明顯影響，對腦膽鹼酯酶 (ChE)活力也無明顯影響，
  - 其改善學習記憶能力作用不是透過興奮M受體或抑制ChE活力。

(2)對腎上腺皮質激素的影響

- 知母能保護腎上腺皮質，減輕糖皮質激素的副作用。
- 知母能使同服地塞米鬆(dexamethasone)的家兔血漿中皮質酮含量明顯上升，其作用機理與抑制腎上腺皮質激素在肝中的分解代謝有關。
- 知母對豚鼠垂體和腎上腺組織形態無明顯影響，但可減輕或部分逆轉長期給予皮質激素所致垂體、腎上腺的組織形態學變化。
- 知母也能拮抗正常人服用地塞米松所致血皮質醇分泌尖峰的抑制，對腎病綜合徵病患可明顯減輕激素所致盈月臉、興奮失眠等副作用，但不影響療效。

(3)抗癌

- 知母皂苷對人肝癌移植裸鼠模型有一定的抑制作用，其作用主要不在於對腫瘤的直接抑制，而是對宿主代謝的調節和糾正。
- 由於惡性腫瘤與細胞膜鈉幫浦密切相關，腫瘤細胞和宿主細胞中鈉幫浦活性均明顯增高，知母能顯著抑制Na^+，K^+ -ATP酶，有助於癌瘤生長的抑制和宿主的存活，也有助於減少機體能量消耗。
- 知母成分芒果苷有明顯鎮靜、利膽作用;
- 異芒果苷有明顯鎮咳、祛痰、強心、利尿作用。

綜述

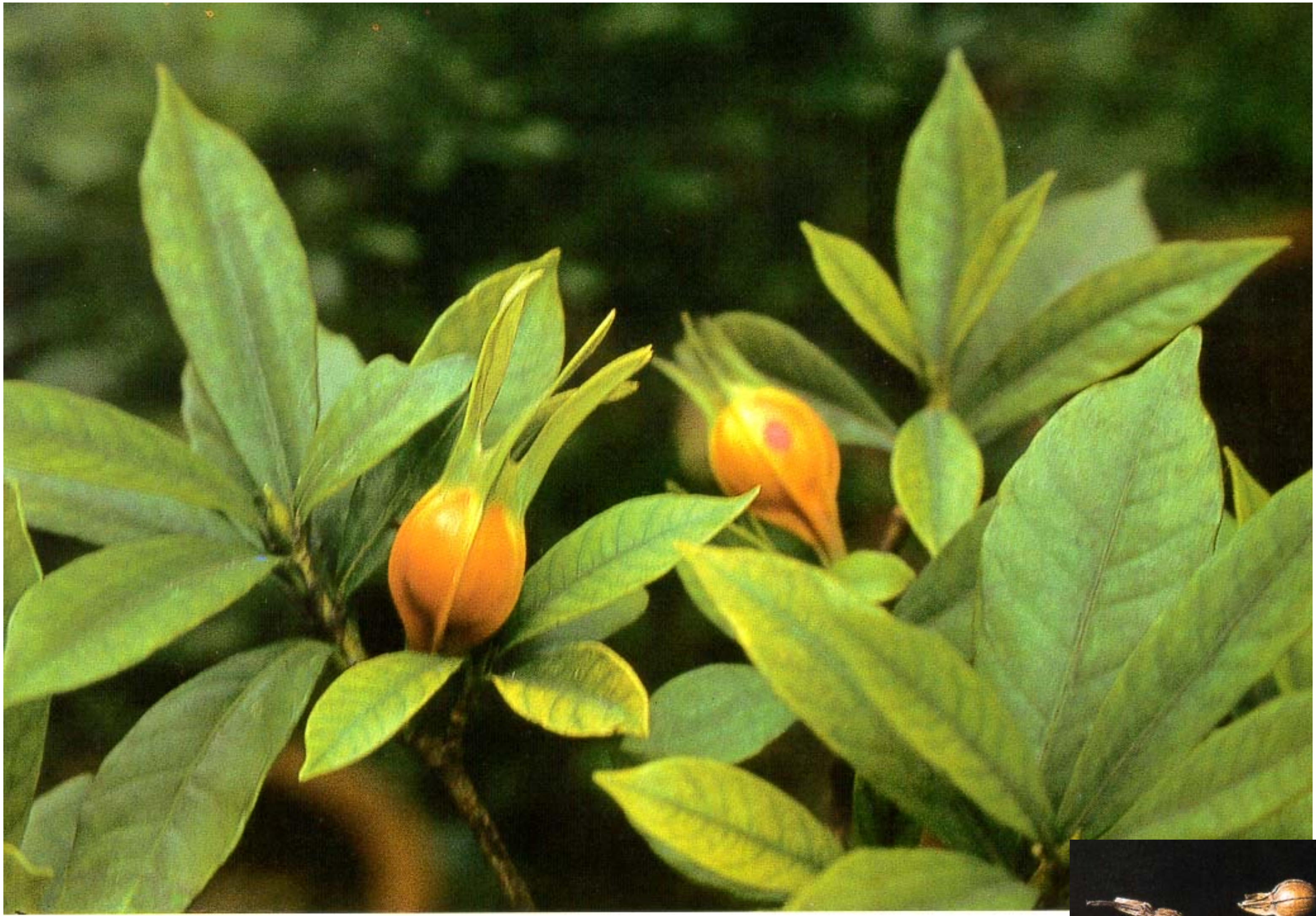
- 與知母清熱瀉火功效相關的藥理作用為抗病原微生物、解熱、抗發炎、對交感神經和β受體功能的調節等作用。主要有效成分是知母皂苷及皂苷元。
- 與知母生津潤燥功效相關的藥理作用為降血糖等作用。主要有效成分為知母聚糖。
- 知母改善學習記憶、對腎上腺皮質及腎上腺皮質激素的調節、抗癌等作用，則是其現代研究進展。

現代應用

1. 急性傳染病、感染性疾病：用知母配伍石膏(白虎湯)等治療流行性出血熱、肺炎、流行性腦膜炎、乙型腦炎、鉤端螺旋體病。
2. 糖尿病：常與天花粉、麥冬等配伍，用於糖尿病的治療。
3. 肺結核潮熱或肺熱咳嗽：可單用知母。
4. 前列腺肥大症：可與黃柏等配伍應用。

梔子

- 茜草科植物梔子*Gadenia jasminoides* Ellis.的乾燥成熟果實。
- 主要化學成分:
  - 苷類，如梔子苷 (Gadenoside)、去烴梔子苷 (京尼平苷 Geniposide)及其水解產物京尼平(genipin)等。
  - β-谷甾醇、藏紅花苷、梔子素、藏紅花酸、熊果酸等成分。
- 味苦，性寒。歸心、肺、三焦經。



與功效主治相關的藥理作用

- 功效：瀉火除煩，清熱利尿，涼血解毒。
- 主治：熱病心煩，黃疸尿赤，血淋澀痛，血熱吐衄，目赤腫痛，火毒瘡瘍;外治扭挫傷痛。
- 朱震亨：本品能瀉三焦火，清胃腕血，治熱煩心痛，解熱鬱，行結氣。
- 藥性論：梔子能利五淋，主中惡，通小便，解五種黃病，明目。治時疾，除熱及消渴、口乾、目赤腫痛。

(1)抗病原體

- 對金黃色葡萄球菌、卡他球菌、淋球菌、腦膜炎雙球菌及毛癬菌、黃癬菌、小芽抱癬菌等多種皮膚真菌均有不同程度的抑制作用。
- 對HBV-DNAP (乙肝病毒-DNA聚合酶)也有抑制作用。
- 腹部感染日本血吸虫尾蚴小鼠，以梔子煎液和青蒿素混合液灌胃治療，能使小鼠減蟲率明顯高於單用青蒿素組，肝臟末發現虫卵結節，多數蟲體滯留在肝臟，蟲體活動力差，有死蟲。

(2)抗發炎

- 梔子水提物對二甲苯所致小鼠耳殼腫脹、醋酸所致小鼠腹腔毛細血管通透性增高、甲醛及角叉菜膠所致大鼠足腫脹、大鼠棉球肉芽組織增生均有明顯的抑制作用。
- 梔子乙醇、甲醇、乙酸乙酯提取物和京尼平苷對二甲苯所致小鼠耳殼腫脹也有明顯抑制作用，
- 梔子甲醇、乙酸乙酯提取物還對甲醛所致大鼠亞急性足腫脹有明顯的抑制作用，另對外傷所致小鼠和家兔實驗性軟組織損傷有明顯治療效果。

(3)鎮靜、鎮痛

- 梔子醇提物腹腔注射或灌胃能減少小鼠自發活動，延長環己烯巴比妥鈉睡眠時間，表明有鎮靜作用。
- 梔子所含成分熊果酸是其鎮靜作用有效成分之一。
- 梔子醇提物及京尼平苷對醋酸誘發的小鼠扭體反應有明顯的抑制作用，表明有鎮痛作用。

(4)降溫和解熱

- 梔子醇提物能使正常大鼠、小鼠體溫顯著下降，作用持久。其中熊果酸是降溫有效成分之一。
- 梔子生品或炮製品的醇提物對酵母所致發熱大鼠有明顯解熱作用，其生品作用較強。

(5)利膽、保肝

- 具有顯著利膽作用。
  - 梔子水煎液口服能使小鼠膽囊收縮。
  - 浸出液能抑制結扎膽管的家兔血中膽紅素的生成，降低血中膽紅素含量。
  - 醇提物和藏紅花苷、藏紅花酸、梔子苷、梔子素、京尼平苷均可促進膽汁分泌。
  - 人口服梔子煎劑後，經膽囊X光片可見膽囊收縮，容積縮小，也表明梔子促進膽汁排泄。

- 具有顯著保肝作用。
  - 梔子不同炮製品對四氯化碳所致小鼠急性肝損傷有明顯保護作用，以生品作用為強，炒炭無效。
  - 梔子水煎液對半乳糖胺引起的大鼠暴發性肝炎有明顯的保護作用，可降低死亡率。
  - 對異硫氰酸α-奈酯 (Anit)所致大鼠急性黃疸模型，可使血清膽紅素、ALT和AST均明顯降低。
  - 梔子正丁醇提取物對Anit所致肝組織灶性壞死、膽管周遭炎相片狀壞死等病理變化有明顯保護作用。

2.其他藥理作用

(1)對胰腺的影響

- 梔子及其提取物能促進大鼠胰腺分泌，降低胰酶活性，對胰腺細胞膜、線粒體膜、溶酶體膜均有穩定作用，能使胰腺細胞膜架構、功能趨於正常。
  - 促進胰腺分泌以京尼平作用最強，
  - 降低胰酶活性以京尼平苷作用最顯著。

(2)對胃腸運動及胃液分泌的影響

- 低濃度梔子乙醇提取液能興奮大鼠、兔小腸運動，高濃度則抑制。
- 靜脈注射京尼平苷和京尼平能抑制大鼠自發性胃蠕動及毛果芸香鹼誘發的胃收縮，但作用短暫。
- 幽門結扎大鼠十二指腸內給藥，京尼平可減少胃液分泌，降低總酸度。

(3)降血壓

- 梔子煎劑和醇提物
  - 對麻醉或正常清醒的貓、大鼠灌胃或腹腔注射均有較持久的降血壓作用。
  - 切斷兩側迷走神經或給予阿托品後，其降血壓作用顯著減弱或完全消失，
  - 故認為其降血壓作用部位在中樞，主要透過增強延腦副交感神經中樞緊張度而發揮降血壓效應。
- 梔子還有抑制心肌收縮力、防治動脈粥狀硬化等作用。

綜述

- 與梔子瀉火除煩功效相關的藥理作用為鎮靜、鎮痛、降溫和解熱等作用。熊果酸是其鎮靜、降溫的主要有效成分之一。
- 與梔子清熱利尿，涼血解毒功效相關的藥理作用為抗病原體、抗發炎、利膽、保肝等作用。京尼平苷是其利膽主要有效成分之一。
- 梔子對胰腺的影響、對胃腸運動及胃液分泌的影響、降血壓等作用，則是其現代研究進展。

現代應用

1. 急性黃疸型肝炎。
2. 扭挫傷：生梔子粉用蛋清和面粉調敷患處，或用溫水調成糊狀，加少許酒精調敷均有效。
3. 急性卡他性結膜炎：用梔子泡水當茶飲。

不良反應

- 梔子醇提物對小鼠腹腔注射的LD50為17.1 g/kg，灌胃為107.4 g/kg。
- 大劑量梔子及其有效成分對肝臟有一定毒性作用。
- 山梔乙醇提取物4 g/kg或京尼平苷250mg/kg給大鼠灌胃，每日1次，共4日，肝微粒體酶P450含量以及對硝基苯甲醚脫甲基酶活性明顯下降，給藥組大鼠肝臟呈灰綠色。

青蒿

- 菊科植物黃花蒿*Artemisia annua* L.的乾燥地上部分。
- 主要含倍半萜類的青蒿素(artemisinin)，青蒿甲、乙、丙、丁、戊素 (artemisinin I、II、III、IV、V)，青蒿酸(artemisic acid)，青蒿酸甲酯(methyl areannuate)，青蒿醇 (artemisinol)等和黃酮香豆素類成分及揮發性成分。
- 味苦、辛，性寒。歸肝、膽經。

與功效主治相關的藥理作用

- 功效：清熱解暑，除蒸，截瘧。
- 主治：暑邪發熱，陰虛發熱，夜熱早涼，骨蒸勞熱，瘧疾寒熱，濕熱黃疸等。
- 本草新編：專解骨蒸勞熱，尤能瀉暑熱之火。
- 本草綱目：青蒿治瘧疾寒熱。

(1)抗病原微生物

- 青蒿水煎液對葡萄球菌、卡他球菌、炭疽桿菌、白喉桿菌有較強的抑菌作用，對金黃色葡萄球菌、痢疾桿菌、綠膿桿菌、結核桿菌等也有一定的抑菌作用。
- 青蒿酸乳劑對枯草桿菌、金黃色葡萄球菌、白色葡萄球菌有一定的抑菌作用。
- 青蒿酯鈉對金黃色葡萄球菌、福氏痢疾桿菌、大腸桿菌、卡他球菌、甲型和乙型副傷寒桿菌及鐵銹色小孢子癬菌、絮狀表皮癬菌均有--定的抑菌作用。

(1)抗病原微生物

- 1%青蒿揮發油對多種皮膚癬菌有抑殺作用。
- 青蒿素對流行性出血熱病毒、流感病毒有抑制作用。
- 青蒿中的谷甾醇和豆甾醇也有一定的抗病毒的效果。
- 青蒿素、青蒿醇提物可降低大腸桿菌內毒素休克小鼠的死亡率。

2) 抗發炎：

1) 青蒿水提物對大鼠、小鼠蛋清性、酵母性關節腫脹和二甲苯所致小鼠耳殼腫脹有明顯的抑制作用。莨菪亭是其抗發炎成分之一。

3) 解熱、鎮痛：

1) 青蒿水提物、乙酸乙酯提取物、正丁醇提取物均有明顯的解熱作用，能使實驗性發熱動物的體溫下降，青蒿水提物還可使正常動物的體溫下降。
2) 在花前期採的青蒿解熱作用強，顯示青蒿的解熱活性物質在花前期含量較高。
3) 對化學刺激法和熱刺激法引起的疼痛反應，青蒿水提物有明顯的抑制作用。

(4)對免疫功能的影響

- 青蒿素對正常動物的網狀內皮系統吞噬功能、淋巴細胞轉化率及血漿cAMP含量均無影響。
- 對皮質激素所致免疫功能低下的動物，青蒿素可使降低的淋巴細胞轉化率增高，又可使升高的血漿cAMP降低;
- 在高瘧原虫血症時，又可使低下的血漿cAMP升高。
- 青蒿琥酯 (Artesunate)可促進Ts細胞增殖，抑制Th細胞產生，阻止白血球介素和各類炎症介質的釋放，從而起到免疫調節作用。

(5)抗瘧原虫

- 青蒿素(Artemisinin)
  - 是青蒿的抗瘧有效成分，具有高效、速效、低毒等特點。
  - 衍生物蒿甲醚、青蒿酯鈉也具有良好抗瘧作用，對鼠瘧、猴瘧和入瘧均有明顯的抑制作用。
  - 體內試驗證明，青蒿素對瘧原虫紅細胞內期有直接殺滅作用，但對紅細胞前期和外期無影響。

(5)抗瘧原虫

- 青蒿素
  - 抗瘧機理主要是影響瘧原虫的膜架構，首先是抑制瘧原虫表膜、線粒體膜，其次是核膜、內質網膜。對核內染色質也有一定的影響。
  - 作用模式主要是影響了表膜-線粒體的功能，阻斷以宿主紅細胞漿為營養的供給。
  - 獨有的過氧基是產生抗瘧作用的必要基團。
  - 對血吸虫成虫具有明顯的殺滅作用。

2.其他藥理作用

1. 對心血管系統的影響：離體兔心灌注青蒿素，能減慢心率、抑制心肌收縮力、減少冠脈流量。兔靜脈注射青蒿素，有降血壓作用。
2. 抗癌：青蒿琥酯對小鼠肝癌、肉瘤S180有抑制作用，青蒿酸和青蒿B衍生物對小鼠白血病細胞、人肝癌細胞SMMC-7721有明顯的殺傷作用，對人胃癌細胞SGC-7901 clone形成有非常明顯的抑制作用。

綜述

- 與青蒿清熱解暑，除蒸功效相關的藥理作用為抗病原微生物、抗內毒素、抗發炎、解熱、鎮痛、免疫調節等作用。
- 與青蒿截瘧功效相關的藥理作用為抗瘧原蟲作用。
- 青蒿主要有效成分是青蒿素。

現代應用

1. 瘧疾：青蒿素製劑及青蒿素治療間日瘧、惡性瘧有良好療效，特別是對抗氯喹瘧疾和腦型惡性瘧療效突出。在療效、低毒優於氯喹(chloroquine)和其他抗瘧藥。缺點是復發率高。
2. 高熱：青蒿水煎液對各種發熱均有一定的療效。
3. 皮膚真菌病和神經性皮炎：青蒿油搽劑外用，對手、足、體、股癬和神經性皮炎均有效。
4. 青蒿及其有效成分對慢性支氣管炎、鼻衄、口腔黏膜扁平苔癬、盤形紅斑性狼瘡、尿豬留等均有一定的治療效果。

不良反應

- 青蒿毒性低，其浸膏片口服少數病患可出現噁心、嘔吐、腹痛、腹瀉等消化道症狀。
- 青蒿油乳劑給小鼠灌胃的LD_{50}為2.10 g/kg。
- 青蒿素給小鼠灌胃的LD_{50}為5.10 g/kg。
- 青蒿琥酯能誘發孕鼠骨髓細胞微核，抑制骨髓造血，而且能透過胎盤屏障損傷胎肝有核細胞。
- 靜脈注射青蒿琥酯的LD_{50}小鼠為0.77g/kg，大鼠為0.55 g/kg。青蒿酯鈉還有明顯的胚胎毒作用。